



PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 02112979 00000000 Folios: 311 n
Fecha (AMB): 2002-12-13 00:55:36
Trámite : 011 PCT-PATENT 279 FASE NACI 411 PRESENTAC

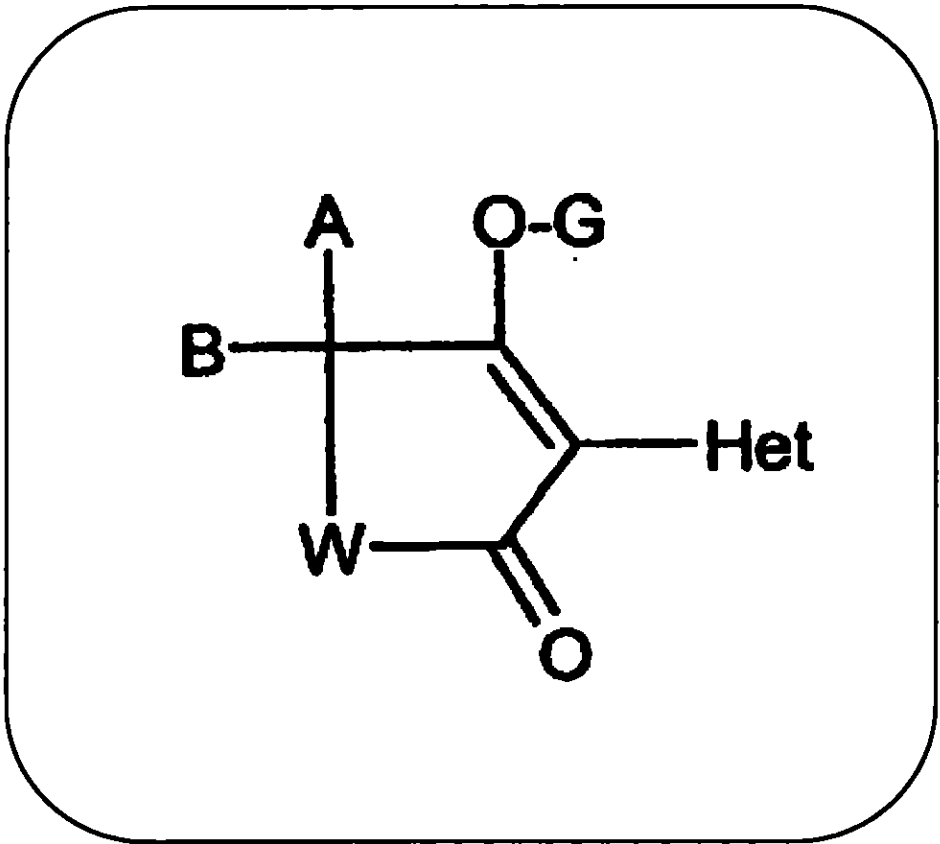
FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

1 SOLICITUD DE:		
☒ Patente de Invención. ☐ Patente de Modelo de Utilidad.		
☐ Capítulo I. ☒ Capítulo II.		
2 SOLICITANTE (71)	Nombre: BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT sociedad constituida y existente bajo las leyes de la República Federal de Alemania. Dirección: D- 51368 Leverkusen, República Federal de Alemania. Domicilio: Leverkusen, República Federal de Alemania.	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número: _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: EMILIO FERRERO Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax:: 217 92 11 E-mail: clientes@camvp.com . Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número: <u>438.019</u> T.P. <u>31.929</u>
4 INVENTOR (ES) (72)	1-Reiner FISCHER Melly-Sachs-Str. 23, 40789 Monheim. República Federal de Alemania. 3- Axel TRAUTWEIN Im Aehlemaer 23, 51467 Bergisch Gladbach, República Federal de Alemania. 5- Mark Wilhelm DREWES Goethestr 38, 40764 Langenfeld República Federal de Alemania. 7- Peter DAHMEN Altebrücker Str. 61, 41470 Neuss, República Federal de Alemania. 9- Rolf PONTZEN Am Kloster 69, 42799 Leichlingen, República Federal de Alemania.	
	2- Thomas BRETSCHNEIDER Talstr. 29b, 53797 Lohmar, República Federal de Alemania. 4- Astrid ULLMANN Merowingerstr. 31, 50677 Köln, República Federal de Alemania. 6- Christoph ERDELEN Unterbüschertshof 15, 42799 Leichlingen, República Federal de Alemania. 8- Dieter FEUCHT Ackerweg 9, 40789 Monheim, República Federal de Alemania.	

5	PCT (88)			
Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP01/08174</u>		Fecha: <u>31 de mayo de 2001</u>		
Publicación Internacional No. <u>WO 01/96333 A1</u>		Fecha : <u>20 de diciembre de 2001</u>		
6	Título (54) <u>HETEROCICLOS HETARIL-SUBSTITUIDOS</u>			
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 417/04 ; A61K 31/427</u>			
8	Prioridad	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
SI ☒ NO ☐		<u>DE.</u>	<u>13 de junio de 2000</u>	<u>100 29 077.9</u>
9	Comprobante de pago No: <u>02-78-528</u> Fecha: <u>25 de noviembre de 2002</u>			
10	Anexos:			
☒	Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 378.000.00.			
☐	Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.			
☒	Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.			
☒	Poderes, si fuere el caso.			
☐	Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.			
☐	Declaraciones.			
☒	Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)			
☒	Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)			
☒	Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.			
☐	Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.			
☐	De ser el caso, copia del contrato de acceso.			
☐	De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.			
☐	De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.			
☒	Arte final 12x12			
☐	De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.			
☐	Otros			

11

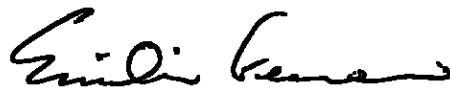
FIGURA CARACTERISTICA:



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA: 

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929



4
0698
6028

CONSULADO DE COLOMBIA

CERTIFICACION

No. 145

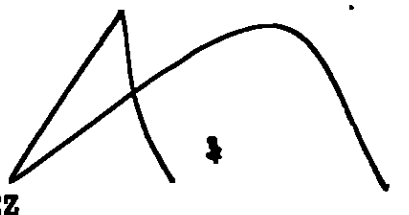
Bonn, 8 de agosto de 1996

El suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares de Colombia en Bonn, vistos los documentos presentados por los interesados, CERTIFICA: Que el señor Dirk Heiderhoff quien como Notario en Leverkusen autentico la firma de los signatarios DR. ROLF BRAUN y DR. JOACHIM GREMM del documento precedente, ejercian en la fecha las funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este Consulado; que la empresa BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT está constituida de acuerdo con las leyes de la República Federal de Alemania y cumple su objeto conforme a las mismas según el Registro Comercial HRB 1122 del Tribunal de Primera Instancia de Leverkusen; que los señores BRAUN y GREMM, quienes firmaron el documento precedente, son los representantes legales de la empresa arriba mencionada.

El suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento.

Pagado el impuesto de timbre
y derechos consulares.

Valor US\$106,00 = DM\$169,60


JUAN PABLO GONZALEZ
Segundo Secretario

Encargado de las Funciones Consulares



DETE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.
1996 AGO 23 A las 5P
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
NO SE ASUME

LA FIRMA ALMENDRA
DOCUMENTO DESAMPARADO
LAS FUNCIONES INDICADAS
1986 22
JUAN PABLO GONZALEZ

Handwritten signature

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª N° 72-35

BOGOTÁ, D. C. COLOMBIA

REPRESENTACION Y PODER

I (we), the undersigned/Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT

of/domiciliado (s) en D-51368 Leverkusen,
GERMANY,

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistirse, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTATION AND POWER OF ATTORNEY

in due compliance with the terms of paragraph 1st of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

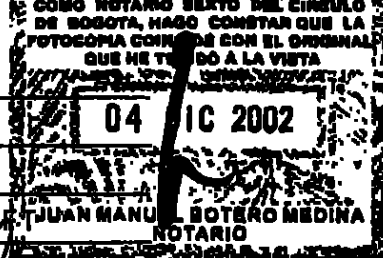
Given and signed this/Dado y firmado hoy

31st July 1996

in/en Leverkusen

BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT

Signature



JUAN MANUEL BOTERO MEDINA

NOTARIO

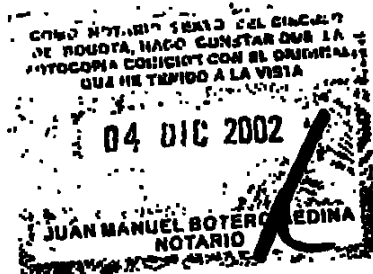
Prima

LEGALIZACION

El Señor Cónsul de Colombia debe expedir un certificado consular sobre (1) la existencia legal de la compañía que otorga el poder, (2) que ésta ejerce su objeto social, y (3) que las personas que otorgan el poder están autorizadas para darlo. A este efecto les solicitamos que muestren al Señor Cónsul las pruebas que acreditan esos hechos (1), (2) y (3).

LEGALIZATION

The Colombia Consul must issue a consular certificate the legal existence of the company which is the Power-of-Attorney, (2) that it is in actual exercise of company purposes, and (3) that the persons who execute the Power of Attorney is authorized to do so. To this effect show the Consul the evidence to prove the above facts and (3).



NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL DE COLOMBIA: Según los artículos 65 del C. de P.C. y 480 del C. de Comercio, si el poderdante es una sociedad, el Señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social y que quien confiere el poder es su representante.

URNr: 199/1996

Ich beglaubige die vor mir vollzogenen Unterschriften der Herren :

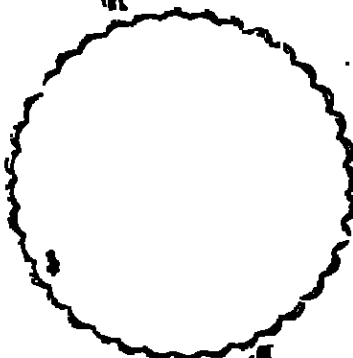
1. Dr. Rolf Braun, geschäftsansässig in D 51368
Leverkusen, Bayerwerk,
2. Dr. Joachim Gremm , geschäftsansässig in D 51368
Leverkusen, Bayerwerk,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht vom heutigen Tage in das Handelsregister des Amtsgerichts Leverkusen - HRB 1122 -, daß die genannten Herren berechtigt sind, die Bayer Aktiengesellschaft in Leverkusen als Prokuristen gemeinschaftlich zu vertreten.

Leverkusen, den 31. Juli 1996

H. Linn
Notar

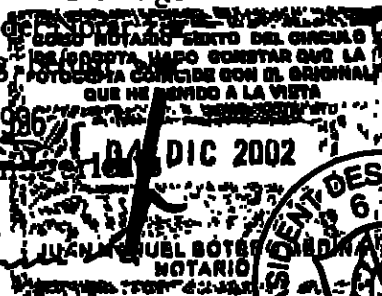


Die Echtheit der vorstehenden Unterschrift
des Notars *Dirk Schindlerhoff* in Leverkusen
sowie die Echtheit des beigefügten Dienst-
siegels werden hiermit bestätigt.
Zugleich wird bescheinigt, daß die
Vorschreibe der Amtshandlung

Köln, den 02. Aug. 1996

Der Präsident des Amtsgerichts

R. Wohrlich
(Dr. Wohrlich)





COMO NOTARIO SEÑTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

04 DIC 2002

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

7

TRADUCCION OFICIAL No. 5424

de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

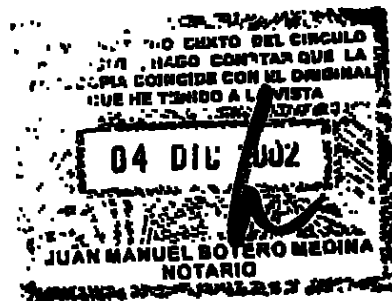
(A continuación de la representación y poder conferido a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO tpa, 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia, el 31 de julio de 1996 por los señores Dr. Rolf Braun y Dr. Joachim Gremm, apoderados de la Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen, RFA:)

Protocolo notarial 1799/1996

Certifico la autenticidad de las firmas puestas ante mí por los señores

1. Dr. Rolf Braun, domiciliado en D 51368 Leverkusen, Bayerwerk,
 2. Dr. Joachim Gremm, domiciliado en D 51368 Leverkusen, Bayerwerk,
- a quienes conozco en persona.-

1



8

Certifico por haber tenido a la vista el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Leverkusen - HRB 1122 - que los señores mencionados están facultados, en su calidad de apoderados, para representar conjuntamente a la Bayer Aktiengesellschaft, domiciliada en Leverkusen.

Leverkusen, 31 de julio de 1996

Fdo.: firma ilegible

Notario

(Hilo y oblea notarial en relieve:)

Dirke Heiderhoff - Notario de Leverkusen

Acid
(dorso:)

Se certifica la autenticidad de la firma antecedente del notario de Leverkusen, Dirke Heiderhoff, y la del sello oficial que la acompaña. Igualmente se certifica que el mencionado notario estaba facultado para realizar ese acto oficial.

Colonia, 02 de agosto de 1996

El Presidente del Juzgado Municipal

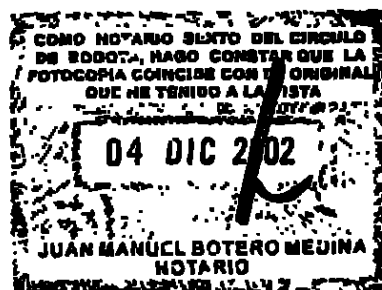
Fdo.: firma ilegible

(Dr. Wohlmich)

(sello redondo en tinata:)

El Presidente del Juzgado Municipal de Colonia

2



EN ESPAÑOL: La legalización de las firmas antecedentes por el Consulado de Colombia en Bonn bajo el No. 145 del 08 de agosto de 1996 y por el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia bajo el No. 198692 del 23 de agosto de 1996.

Pagados Impuesto de timbre y derechos consulares US\$ 106,--

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Santafé de Bogotá, 2 de septiembre de 1996

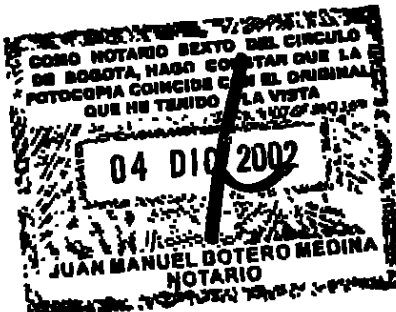
COMO NOTARIO SEXTO DE SANTAFE DE BOGOTA
HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA DE
[Firma manuscrita]
C. C. *[Firma manuscrita]*
COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLOS)
EN ESTA NOTARIA.

SANTAFE DE BOGOTA, D.C.



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES
205396
22 AGO 96
D.C. 1996
COPIA FIEL
LAS OFICINAS
DE BOGOTA

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD
POR EL
22 SET 96
DEFE DE RELACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.



CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI
CARRERA 41, No 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

TELEFAX (57) (11) 2358850
CABLES CAVELEYES
TELEX: 45479

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE
TELEFONO: (57) (11) 2120100

Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Poderdante: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 31-07-96

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,



GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

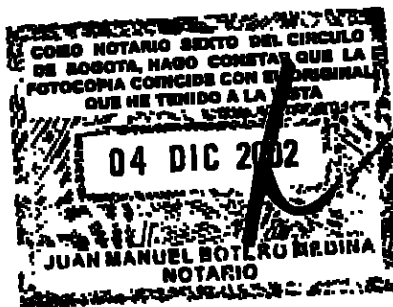
Acepto:



EMILIO FERRERO

T.P.A. No 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén



2e-780-2

NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Santafé de Bogotá D. C. **06 SET 1998**

Ante Mí JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO SEXTO DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ

Compareció(en) personalmente,

[Firma] [Firma]

[Firma] [Firma]

quien(es) exhibió(eron) la(s) C. C.

478019

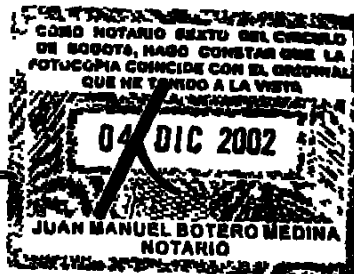
y la(s) Libreta(s) de Identificación,

2877924
77852 7787929

dominical(es) de la(s) y la(s) que la(s) firma(s) que
aparece(n) en el presente documento, a(s) su(s) y que
el contenido de los mismos es verídico y
En consecuencia es de mi obligación.

[Firma]

[Firma]



(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
20. Dezember 2001 (20.12.2001).

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/96333 A1 not. JS

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 417/04,
A01N 43/78

40789 Monheim (DE). PONTZEN, Rolf [DE/DE]; Am
Kloster 69, 42799 Leichlingen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/06174

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-
SELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:
31. Mai 2001 (31.05.2001)

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ,
LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN,
MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI,
SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU,
ZA, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 29 077.9 13. Juni 2000 (13.06.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE];
51368 Leverkusen (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): FISCHER, Reiner
[DE/DE]; Nelly-Sachs-Str. 23, 40789 Monheim (DE).
BRETSCHNEIDER, Thomas [DE/DE]; Talstr. 29b,
53797 Lohmar (DE). TRAUTWEIN, Axel [DE/DE]; Im
Aehlemaar 23, 51467 Bergisch Gladbach (DE). ULL-
MANN, Astrid [DE/DE]; Merowingerstr. 31, 50677 Köln
(DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestr.
38, 40764 Langenfeld (DE). ERDELEN, Christoph
[DE/DE]; Unterbüschhof 15, 42799 Leichlingen (DE).
DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altebrücker Str. 61, 41470
Neuss (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9,

Veröffentlicht:

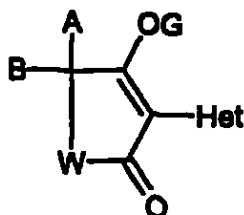
- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.

LeA 34460

(54) Title: HETARYL-SUBSTITUTED HETEROCYCLES

(54) Bezeichnung: HETARYLSUBSTITUIERTE HETEROCYCLLEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to novel compounds of formula (I) in which A,
B, W, G and Het have the same designation cited in the description. The invention
also relates to several methods for the production of said new compounds and the use
thereof as pesticides and herbicides.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft neue Verbindungen der
Formel (I), in welcher A, B, W, G und Het die in der Beschreibung angegebene Bedeu-
tung haben, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schäd-
lingsbekämpfungsmittel und Herbizide.

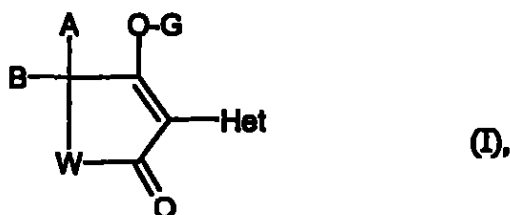
WO 01/96333 A1

Hetarylsubstituierte Heterocyclen

Die vorliegende Erfindung betrifft neue hetarylsubstituierte Heterocyclen, mehrere
5 Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel und Herbizide.

Bekannt sind 4-Thiazolyl-3-hydroxy-3-pyrrolin-2,5-dione als Glykolsäureoxidase-
10 Inhibitoren; US 4,296,237; US 4,377,588; EP-A-025 232; Rooney C.S. et al., J. Med. Chem. 26 700-714 (1983); Guzel Y. et al. THEOCHEM 366 131-137 (1996).

Es wurden nun neue Verbindungen der Formel (I) gefunden



15 in welcher

W für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) steht,

20 Het für jeweils gegebenenfalls substituiertes Thiazolyl, Oxazolyl oder Pyrazolyl steht,

A für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls mindestens ein Ringatom durch ein Heteroatom ersetzt ist, oder
25 jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,

B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, oder

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind für einen gesättigten oder ungesättigten, gegebenenfalls mindestens ein Heteroatom enthaltenden unsubstituierten oder substituierten Cyclus stehen,

5

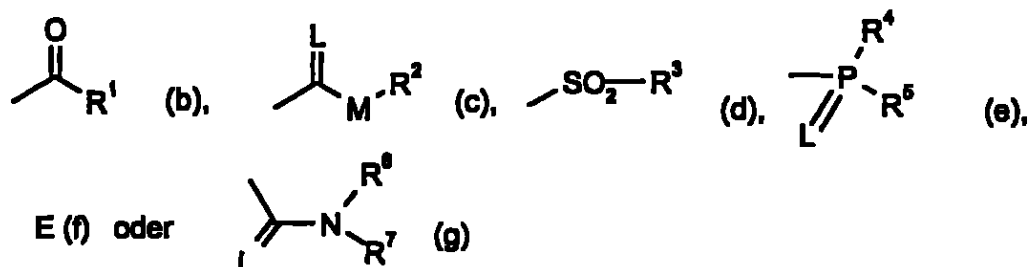
D für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eines oder mehrere Ringglieder durch Heteroatome ersetzt sind, Arylalkyl, Aryl, Hetarylalkyl oder Hetaryl steht oder

10

A und D gemeinsam mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen gesättigten oder ungesättigten und gegebenenfalls mindestens ein Heteroatom enthaltenden, im A,D-Teil unsubstituierten oder substituierten Cyclus stehen,

15

G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppe



20

steht,

worin

E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

25

L für Sauerstoff oder Schwefel steht,

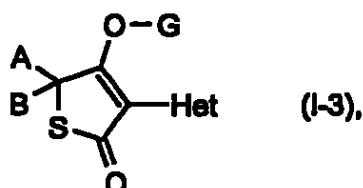
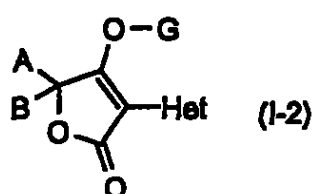
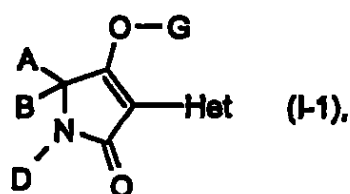
- M für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- 5 R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl oder Alkoxy substituiertes Cycloalkyl, das durch mindestens ein Heteroatom unterbrochen sein kann, jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenylalkyl, Hetaryl, Phenoxyalkyl oder Hetaryloxyalkyl steht,
- 10 R² für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl steht,
- 15 R³ für Alkyl, Halogenalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
- 20 R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylthio, Alkenylthio, Cycloalkylthio und für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenoxy oder Phenylthio stehen,
- 25 R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, für gegebenenfalls substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls substituiertes Benzyl stehen, oder gemeinsam mit dem N-Atom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch Sauerstoff oder Schwefel unterbrochenen Cyclus stehen.

30 Die Verbindungen der Formel (I) können, auch in Abhängigkeit von der Art der Substituenten, als geometrische und/oder optische Isomere oder Isomerengemische, in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen, die gegebenenfalls in üblicher Art

und Weise getrennt werden können. Sowohl die reinen Isomeren als auch die Isomergemische, deren Herstellung und Verwendung sowie diese enthaltende Mittel sind Gegenstand der vorliegenden Erfindung. Im folgenden wird der Einfachheit halber jedoch stets von Verbindungen der Formel (I) gesprochen, obwohl sowohl die
 5 reinen Verbindungen als gegebenenfalls auch Gemische mit unterschiedlichen Anteilen an isomeren Verbindungen gemeint sind.

Unter Einbeziehung von W = N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-1) bis (I-3):

10



worin

A, B, D und G die oben angegebene Bedeutung haben und

15

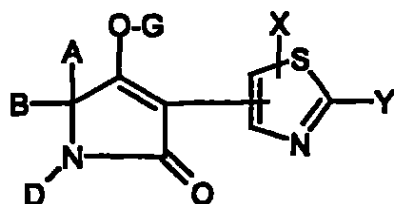
Het für Thiazolyl oder Oxazolyl steht.

Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen von Het ergeben sich folgende hauptsächlichen Strukturen:

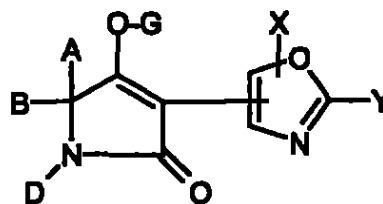
20

(I-1-A) bis (I-3-B) wenn W für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) steht

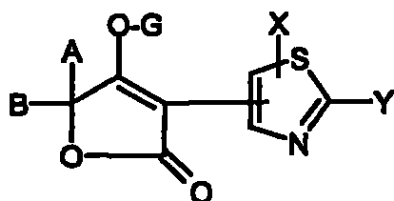
(I-1-A):



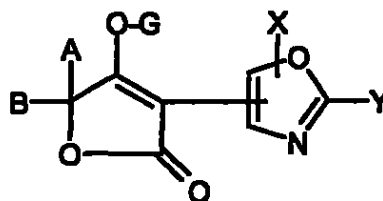
(I-1-B):



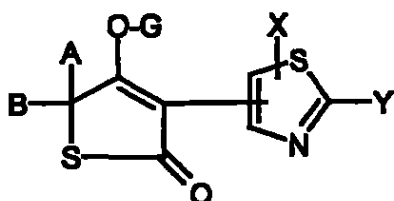
(I-2-A):



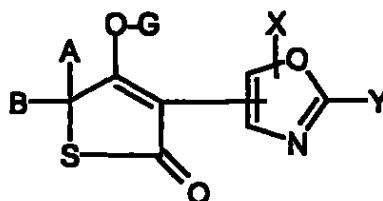
(I-2-B):



(I-3-A):



(I-3-B):



in welchen

5 A, B, D und G die oben angegebene Bedeutung haben und

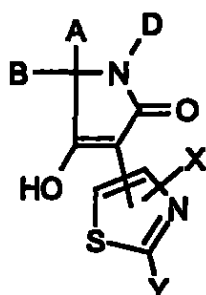
X für Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkenyloxy, Haloalkenyloxy, Nitro, Cyano oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,

10

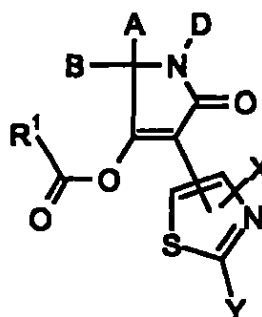
Y für Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkenyloxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfoxinyl, Alkylsulfonyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenoxy oder Phenylthio steht.

Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-1-A-a) bis (I-1-A-g), wenn W für N-D (I) steht,

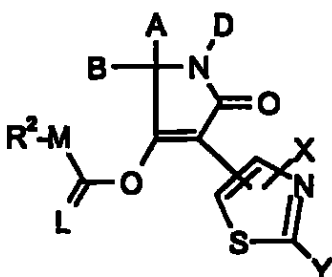
(I-1-A-a):



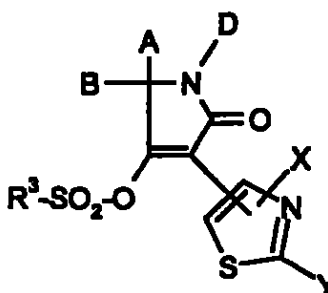
(I-1-A-b):



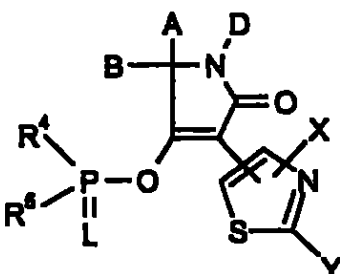
(I-1-A-c):



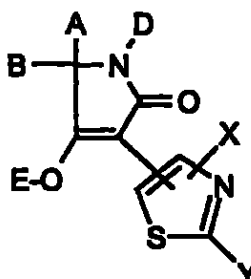
(I-1-A-d):



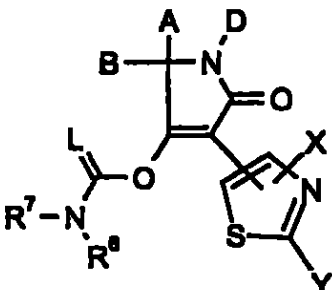
(I-1-A-e):



(I-1-A-f):



(I-1-A-g):



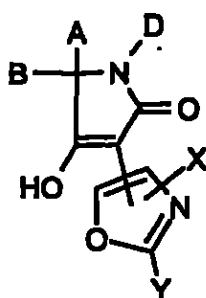
worin

A, B, D, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen besitzen.

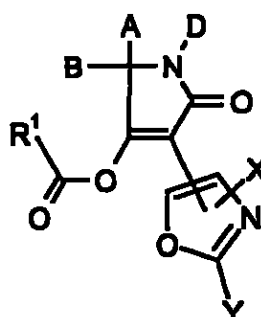
5

Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-1-B-a) bis (I-1-B-g), wenn W für N-D ⁽¹⁾ steht,

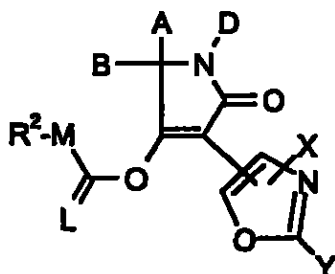
(I-1-B-a):



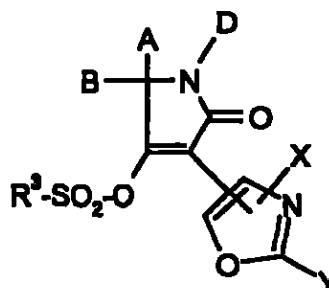
(I-1-B-b):



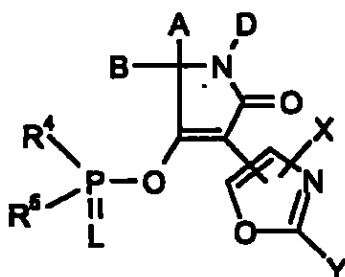
(I-1-B-c):



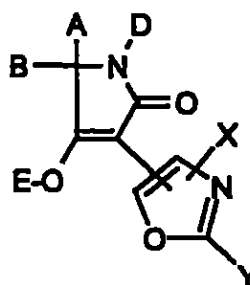
(I-1-B-d):



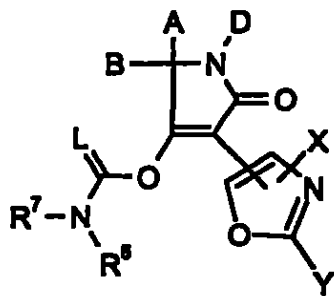
(I-1-B-e):



(I-1-B-f):



(I-1-B-g):



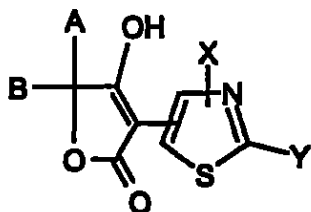
worin

A, B, D, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen besitzen.

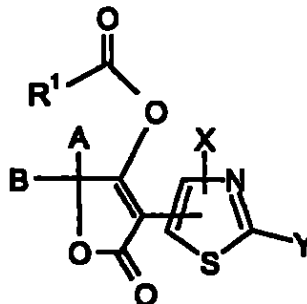
5

Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-2-A-a) bis (I-2-A-g), wenn W für Sauerstoff⁽²⁾ steht,

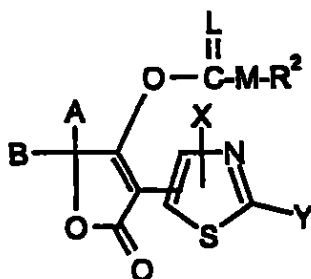
(I-2-A-a):



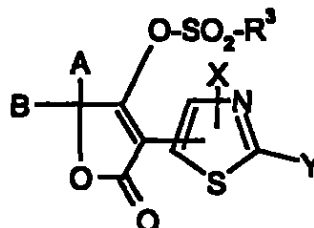
(I-2-A-b):



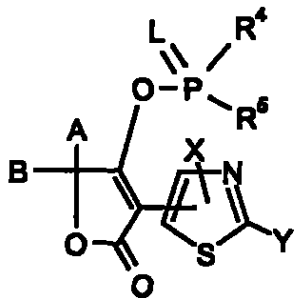
(I-2-A-c):



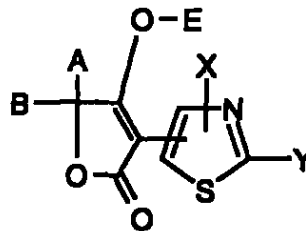
(I-2-A-d):



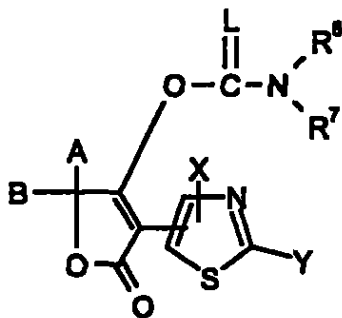
(I-2-A-e):



(I-2-A-f):



(I-2-A-g):



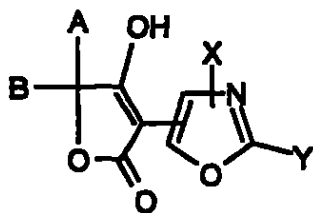
worin

5 A, B, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebene Bedeutung haben.

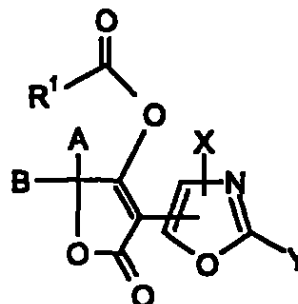
Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-2-B-a) bis (I-2-B-g), wenn W für Sauerstoff⁽²⁾ steht,

10

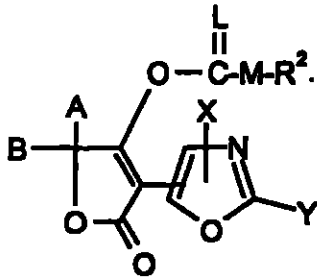
(I-2-B-a):



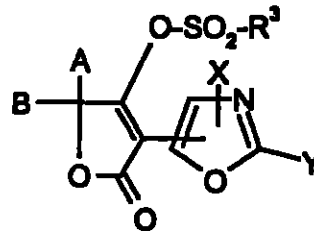
(I-2-B-b):



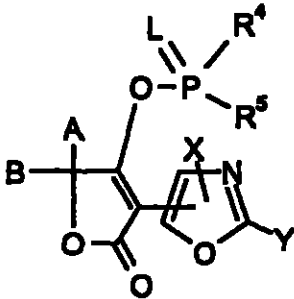
(1-2-B-c):



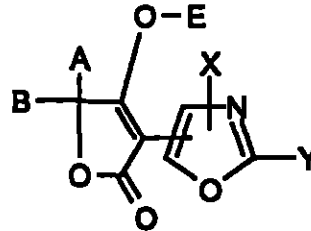
(1-2-B-d):



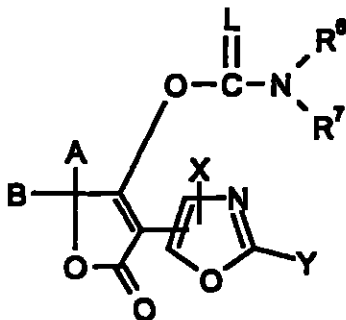
(1-2-B-e):



(1-2-B-f):



(1-2-B-g):

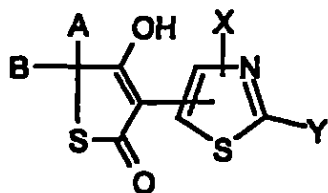


worin

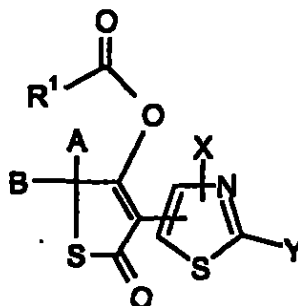
5 A, B, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebene Bedeutung haben.

Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-3-A-a) bis (I-3-A-g), wenn W für Schwefel (3) steht,

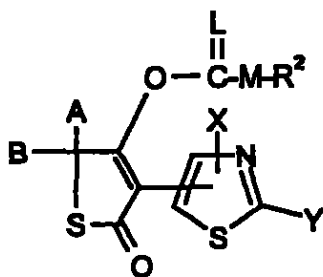
(I-3-A-a):



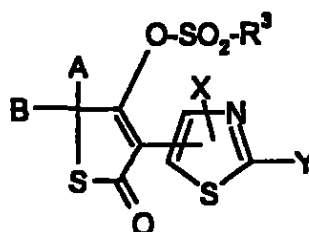
(I-3-A-b):



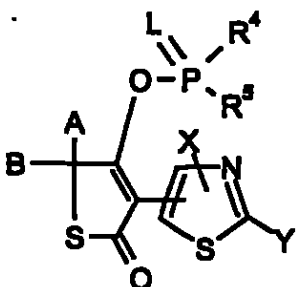
(I-3-A-c):



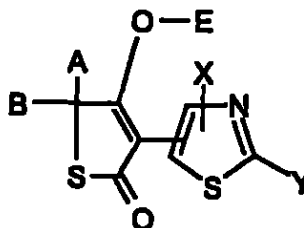
(I-3-A-d):



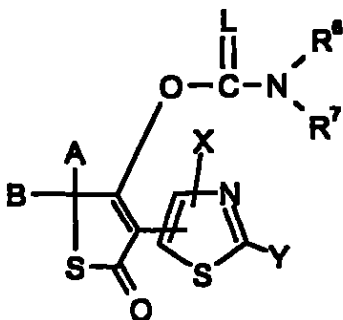
(I-3-A-e):



(I-3-A-f):



(I-3-A-g):

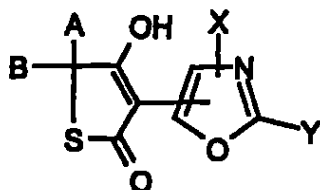


worin

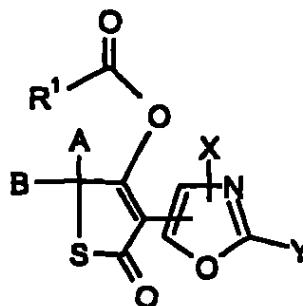
A, B, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutung besitzen.

5 Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-3-B-a) bis (I-3-B-g), wenn W für Schwefel (S) steht,

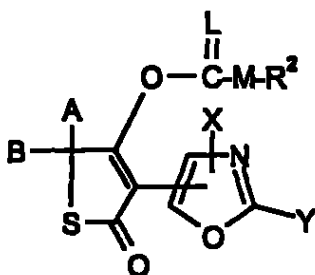
(I-3-B-a):



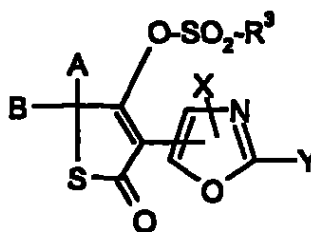
(I-3-B-b):



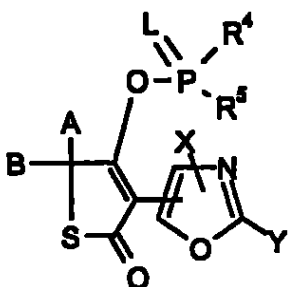
(I-3-B-c):



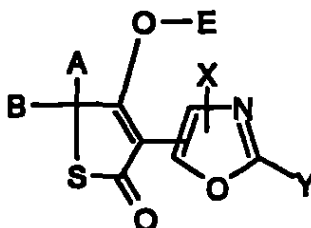
(I-3-B-d):



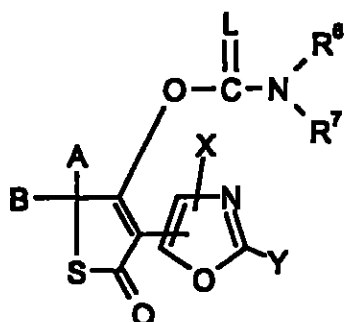
(I-3-B-e):



(I-3-B-f):



(I-3-B-g):

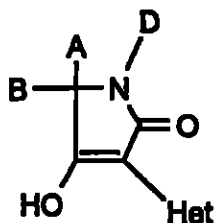


worin

5 A, B, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutung besitzen.

Weiterhin wurde gefunden, dass man die neuen Verbindungen der Formel (I) nach einem der im folgenden beschriebenen Verfahren erhält:

- 10 (A) Man erhält substituierte 3-Hetaryl-pyrrolidin-2,4-dione bzw. deren Enole der Formel (I-1-A-a) bis (I-1-B-a)



(I-1-A-a) bis (I-1-B-a)

in welcher

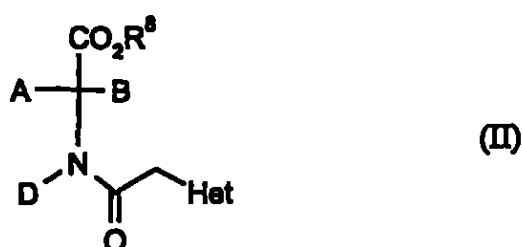
15

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

wenn man

20

N-Acylaminosäureester der Formel (II)



in welcher

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

und

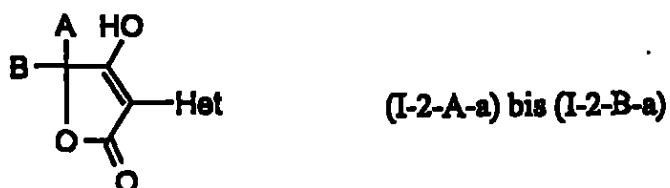
R^8 für Alkyl (bevorzugt C_1 - C_6 -Alkyl) steht,

10

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert.

(B) Außerdem wurde gefunden, dass man substituierte 3-Hetaryl-4-hydroxy- Δ^3 -dihydrofuranon-Derivate der Formel (I-2-A-a) bis (I-2-B-a)

15



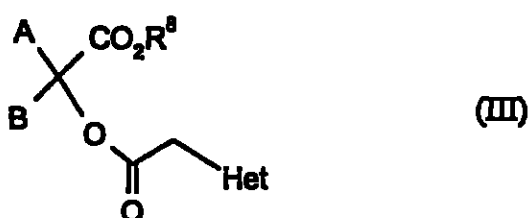
in welcher

A, B und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

erhält, wenn man

Carbonsäureester der Formel (III)



in welcher

A, B, Het und R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert.

(C) Weiterhin wurde gefunden, dass man substituierte 3-Hetaryl-4-hydroxy- Δ^3 -dihydrothiophen-2-on-Derivate der Formel (I-3-A-a) bis (I-3-B-a)

10



in welcher

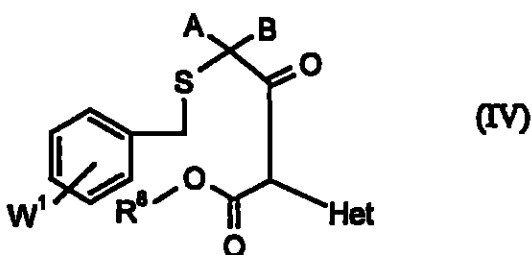
15

A, B und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man

β -Ketocarbonsäureester der Formel (IV)

20



in welcher

A, B, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5 W¹ für Wasserstoff, Halogen, Alkyl (bevorzugt C₁-C₆-Alkyl) oder Alkoxy (bevorzugt C₁-C₈-Alkoxy) steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Säure intramolekular cyclisiert.

10

Außerdem wurde gefunden

(D) dass man die Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-b) bis (I-3-B-b), in welchen A, B, D, R¹ und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), in welchen A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

15

(α) mit Säurehalogeniden der Formel (V)

20



in welcher

R¹ die oben angegebene Bedeutung hat und

25

Hal für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht

oder

30 (β) mit Carbonsäureanhydriden der Formel (VI)



in welcher

5

R^1 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt;

10

(E) dass man die Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-c) bis (I-3-B-c), in welchen A, B, D, R^2 , M und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben und L für Sauerstoff steht, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), in welchen A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

15

mit Chlorameisensäureestern oder Chlorameisensäurethioestern der Formel (VII)

20



in welcher

R^2 und M die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt;

30

(F) dass man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-c) bis (I-3-B-c), in welchen A, B, D, R^2 , M und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben und L für Schwefel steht, erhält, wenn man Verbindungen der oben

gezeigten Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), in welchen A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

5 mit Chlormonothioameisensäureestern oder Chlordithioameisensäureestern der Formel (VIII)



in welcher

M und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt

und

15

(G) dass man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-d) bis (I-3-B-d), in welchen A, B, D, R³ und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), in welchen A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen

20 haben, jeweils

mit Sulfonsäurechloriden der Formel (IX)



25

in welcher

R³ die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt,

- (H) dass man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-e) bis (I-3-B-e), in welchen A, B, D, L, R⁴, R⁵ und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), in welchen A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

mit Phosphorverbindungen der Formel (X)



in welcher

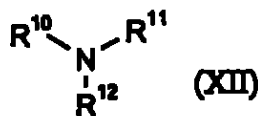
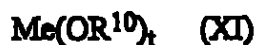
L, R⁴ und R⁵ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt,

- (I) dass man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-f) bis (I-3-B-f), in welchen A, B, D, E und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), in welchen A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

mit Metallverbindungen oder Aminen der Formeln (XI) oder (XII)



in welchen

Me für ein ein- oder zweiwertiges Metall (bevorzugt ein Alkali- oder Erdalkalimetall wie Lithium, Natrium, Kalium, Magnesium oder Calcium),

t für die Zahl 1 oder 2 und

R¹⁰, R¹¹, R¹² unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Alkyl (bevorzugt C₁-C₈-Alkyl) stehen,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

(J) dass man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-g) bis (I-3-B-g), in welchen A, B, D, L, R⁶, R⁷ und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), in welchen A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

(α) mit Isocyanaten oder Isothiocyanaten der Formel (XIII)



in welcher

R⁶ und L die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt oder

- (B) mit Carbamidsäurechloriden oder Thiocarbamidsäurechloriden der Formel (XIV)



in welcher

5

L, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels, umgesetzt.

10

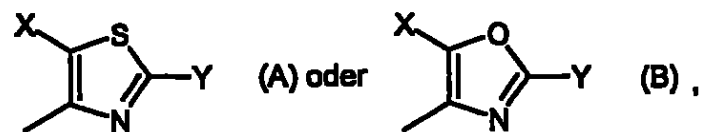
Weiterhin wurde gefunden, dass die neuen Verbindungen der Formel (I) eine sehr gute Wirksamkeit als Schädlingsbekämpfungsmittel, vorzugsweise als Insektizide, Akarizide und Herbizide aufweisen.

15

Die erfindungsgemäßen Verbindungen sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in der oben und nachstehend erwähnten Formeln aufgeführten Reste werden im folgenden erläutert:

Het steht bevorzugt für

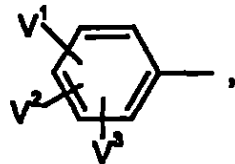
20



X steht bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, Nitro oder Cyano,

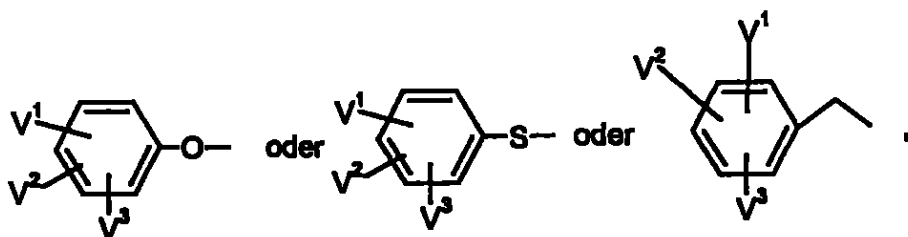
25

Y steht bevorzugt für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylsulfoxinyl oder für die Gruppe



5

oder im Falle von Het = Thiazolyl ((I-1-A) bis (I-3-A)) auch für



10

V¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano, Phenoxy oder jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkylthio,

15

V² und V³ stehen bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy oder

20

V¹ und V² stehen zusammen gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind bevorzugt für einen gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituierten gesättigten oder ungesättigten 5- oder 6-gliedrigen

25

Cyclus, in welchem gegebenenfalls ein bis drei Kohlenstoffatome durch Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff ersetzt sein können,

- W steht bevorzugt für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3),
- 5 A steht bevorzugt für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, Poly-C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht
- 10 direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes C₆- oder C₁₀-Aryl (Phenyl oder Naphthyl), Hetaryl mit 5 bis 6
- 15 Ringatomen (beispielsweise Furanyl, Pyridyl, Imidazolyl, Triazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Thiazolyl oder Thienyl) oder C₆- oder C₁₀-Aryl-C₁-C₆-alkyl (Phenyl-C₁-C₆-alkyl oder Naphthyl-C₁-C₆-alkyl),
- B steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl oder
- 20 A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für gesättigtes C₃-C₁₀-Cycloalkyl oder ungesättigtes C₅-C₁₀-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und
- 25 welche gegebenenfalls einfach oder zweifach durch C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, Halogen oder Phenyl substituiert sind oder
- A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für
- 30 C₅-C₆-Cycloalkyl, welches durch eine gegebenenfalls ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthaltende Alkylendiyl-, oder durch eine Alkylendioxy- oder

durch eine Alkylendithioyl-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- bis sechsgliedrigen Ring bildet der gegebenenfalls einfach bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, oder

5

A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₅-C₈-Cycloalkenyl, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder Halogen substituiertes C₂-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl oder C₄-C₆-Alkandiendiyl stehen, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

10

D steht bevorzugt für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder Cyano substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Hetaryl mit 5 oder 6 Ringatomen (beispielsweise Furanyl, Imidazolyl, Pyridyl, Thiazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Pyrrolyl, Thienyl oder Triazolyl), Phenyl-C₁-C₆-alkyl oder Hetaryl-C₁-C₆-alkyl mit 5 oder 6 Ringatomen (beispielsweise Furanyl, Imidazolyl, Pyridyl, Thiazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Pyrrolyl, Thienyl oder Triazolyl) oder

15

20

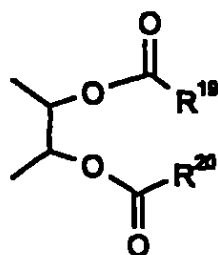
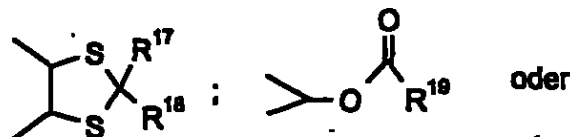
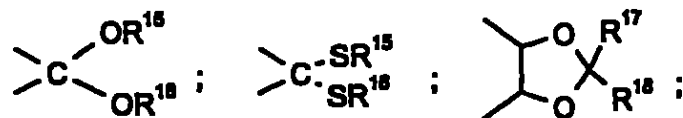
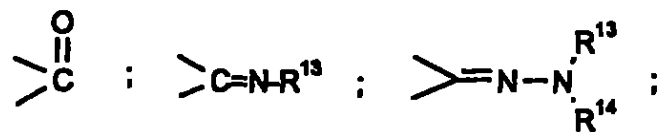
25

A und D stehen gemeinsam bevorzugt für jeweils gegebenenfalls substituiertes C₃-C₆-Alkandiyl oder C₃-C₆-Alkendiyl, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe, Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und

30

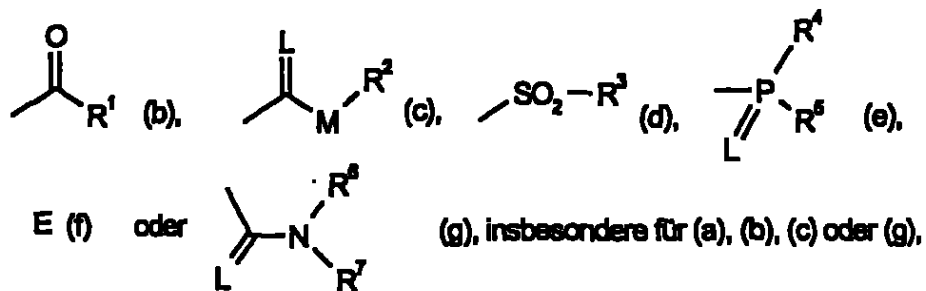
wobei als Substituenten jeweils in Frage kommen:

Halogen, Hydroxy, Mercapto oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyloxy, oder eine weitere C₃-C₆-Alkandiyldgruppierung, C₃-C₆-Alkandiyldgruppierung oder eine Butadienyldgruppierung, die gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl substituiert ist oder in der gegebenenfalls zwei benachbarte Substituenten mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen weiteren gesättigten oder ungesättigten Cyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden (im Fall der Verbindung der Formel (I-1-A) bis (I-1-B) stehen A und D dann gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind beispielsweise für die weiter unten genannten Gruppen AD-1 bis AD-10), der Sauerstoff oder Schwefel enthalten kann, oder worin gegebenenfalls eine der folgenden Gruppen



enthalten ist,

G steht bevorzugt für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



5 in welchen

E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

10

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

15 R¹ steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₁-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder mehrere (bevorzugt nicht mehr als zwei) nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind,

20

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl substituiertes Phenyl,

für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl-C₁-C₆-alkyl,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes 5- oder 6-gliedriges Hetaryl (beispielsweise Pyrazolyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Furanyl oder Thienyl),

10 für gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiertes Phenoxy-C₁-C₆-alkyl oder

für gegebenenfalls durch Halogen, Amino oder C₁-C₆-Alkyl substituiertes 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy-C₁-C₆-alkyl (beispielsweise Pyridyloxy-C₁-C₆-alkyl, Pyrimidyloxy-C₁-C₆-alkyl oder Thiazolyloxy-C₁-C₆-alkyl).

15

R² steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl,

20

für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl in welchem gegebenenfalls ein Ringatom durch Sauerstoff ersetzt ist, oder

25

für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl.

R³

30

steht bevorzugt für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl.

- R⁴ und R⁵** stehen bevorzugt unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkyl-amino, Di-(C₁-C₈-alkyl)amino, C₁-C₈-Alkylthio, C₂-C₈-Alkenylthio, C₃-C₇-Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio,
- R⁶ und R⁷** stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Phenyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Benzyl oder zusammen für einen gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl substituierten C₃-C₆-Alkylrest, in welchem gegebenenfalls ein Kohlenstoffatom durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,
- R¹³** steht bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkoxy,
- R¹⁴** steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₈-Alkyl oder
- R¹³ und R¹⁴** stehen gemeinsam bevorzugt für C₄-C₆-Alkandiyl.

R^{15} und R^{16} sind gleich oder verschieden und stehen bevorzugt für C_1 - C_6 -Alkyl oder

5 R^{15} und R^{16} stehen gemeinsam bevorzugt für einen C_2 - C_4 -Alkandiylrest, der gegebenenfalls durch C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl oder durch gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl substituiert ist.

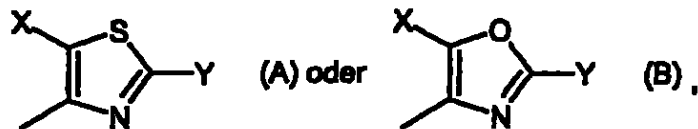
10 R^{17} und R^{18} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C_1 - C_8 -Alkyl oder für gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl oder

15 R^{17} und R^{18} stehen gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt für eine Carbonylgruppe oder für gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes C_5 - C_7 -Cycloalkyl, in dem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

20 R^{19} und R^{20} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_1 - C_{10} -Alkoxy, C_1 - C_{10} -Alkylamino, C_3 - C_{10} -Alkenylamino, Di- $(C_1$ - C_{10} -alkyl)amino oder Di- $(C_3$ - C_{10} -alkenyl)amino.

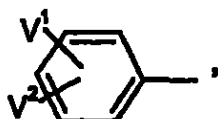
25 In den als bevorzugt genannten Restdefinitionen steht Halogen für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

Het steht besonders bevorzugt für



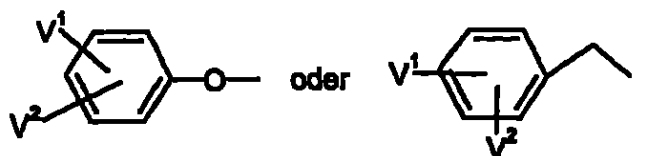
X steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, Nitro oder Cyano,

5 Y steht besonders bevorzugt für Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder für die Gruppe



10

oder im Falle von Het = Thiazolyl ((I-1-A) bis (I-3-A)) auch für



15 V¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano, Phenoxy oder jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenoxy-
20 C₁-C₂-alkyl, Phenyl-C₁-C₂-alkoxy, Phenylthio-C₁-C₂-alkyl oder Phenyl-C₁-C₂-alkylthio,

V² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy oder

25

V¹ und V² stehen zusammen gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind besonders bevorzugt für einen gegebenenfalls durch Fluor oder

Methyl substituierten 5- oder 6-gliedrigen Cyclus, in welchem gegebenenfalls ein bis zwei Kohlenstoffatome durch Sauerstoff ersetzt sein können.

- W steht besonders bevorzugt für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3),
- 5 A steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder
- 10 Schwefel ersetzt ist oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Phenyl-C₁-C₂-alkyl,
- B steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl oder
- 15 A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen besonders bevorzugt für gesättigtes C₅-C₇-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach oder zweifach durch C₁-C₆-Alkyl, C₅-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl,
- 20 C₁-C₆-Alkoxy, Fluor, Chlor oder Phenyl substituiert ist oder
- A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen besonders bevorzugt für C₅-C₆-Cycloalkyl, welches durch eine gegebenenfalls ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthaltende Alkylendiyl- oder durch eine Alkylendioxy- oder durch eine Alkylendithioyl-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlen-
- 25 stoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- oder sechsgliedrigen Ring bildet der gegebenenfalls einfach bis dreifach durch C₁-C₃-Alkyl substituiert sein kann, oder
- 30 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen besonders bevorzugt für C₅-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl, in welchen zwei Sub-

stituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind,
 für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₅-Alkoxy, Fluor, Chlor
 oder Brom substituiertes C₂-C₄-Alkandiyl, C₂-C₄-Alkendiyl, worin gegebene-
 nenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder
 Butadiendiyl stehen,

5

D steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch
 Fluor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-
 alkyl oder C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor,
 C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₇-
 Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauer-
 stoff oder Schwefel ersetzt ist oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor,
 Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder
 C₁-C₂-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl, oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder

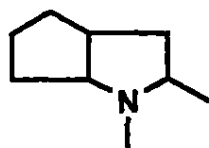
10

15

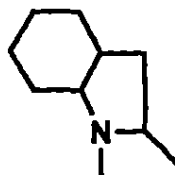
A und D stehen gemeinsam besonders bevorzugt für gegebenenfalls substituiertes
 C₃-C₅-Alkandiyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch
 eine Carbonylgruppe, Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein kann, wobei als
 Substituenten Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy in Frage kommen
 oder

20

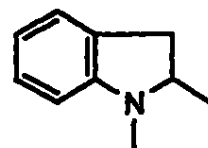
A und D stehen gemeinsam besonders bevorzugt mit den Atomen, an die sie
 gebunden sind, für eine der Gruppen AD-1 bis AD-10:



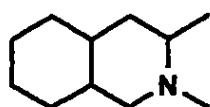
AD-1



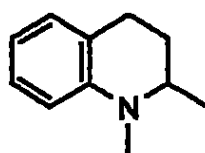
AD-2



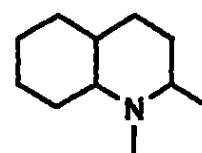
AD-3



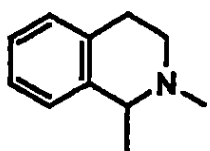
AD-4



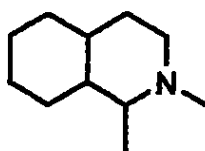
AD-5



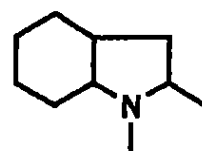
AD-6



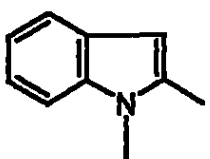
AD-7



AD-8

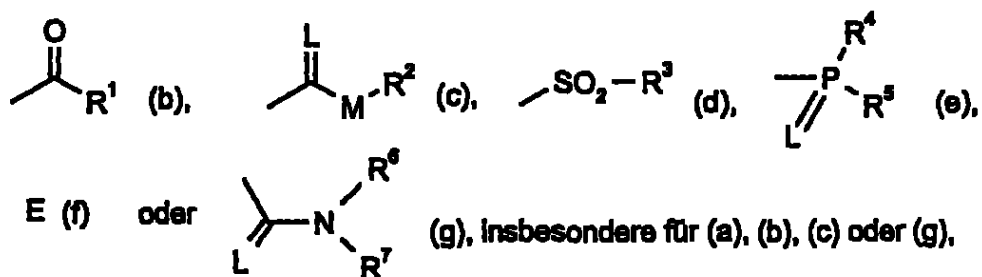


AD-9



AD-10

G steht besonders bevorzugt für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



5 in welchen

E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

10

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R¹ steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₅-Alkyl oder C₁-C₅-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind,

5

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Phenyl,

10

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl oder C₁-C₃-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl-C₁-C₄-alkyl,

15

für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, Trifluormethyl oder C₁-C₂-Alkoxy substituiertes Pyrazolyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Furanyl oder Thienyl.

R²

steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl,

20

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl oder

25

für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl.

R³

30

steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl.

R⁴ steht besonders bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₄-Alkenylthio, C₃-C₆-Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Halogenalkylthio, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio.

R⁵ steht besonders bevorzugt für C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Alkylthio.

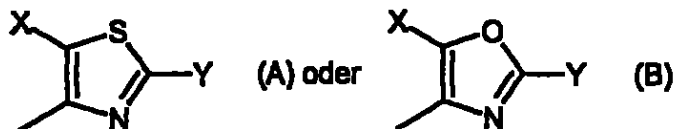
R⁶ steht besonders bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Benzyl,

R⁷ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, oder

R⁶ und R⁷ stehen besonders bevorzugt zusammen für einen gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl substituierten C₄-C₅-Alkylrest, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

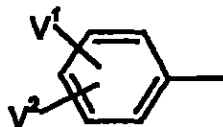
In den als besonders bevorzugt genannten Restdefinitionen steht Halogen für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

Het steht ganz besonders bevorzugt für



X steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl oder iso-Butyl,

Y steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl oder für die Gruppe



oder im Falle von Het = Thiazolyl ((I-1-A) bis (I-3-A)) auch für



V¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Cyano, Phenoxy oder gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl,

V² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy oder

V¹ und V² stehen zusammen ganz besonders bevorzugt für -O-CH₂-O-, -O-CF₂-O- oder -O-CF₂-CF₂-O-.

W steht ganz besonders bevorzugt für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3),

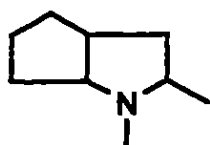
- 5 A steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Methyl, Ethyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl,
- 10 B steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl oder
- 15 A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen ganz besonders bevorzugt für gesättigtes C₅-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, iso-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Propoxy, iso-Propoxy, Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist oder
- 20 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen ganz besonders bevorzugt für C₆-Cycloalkyl, welches durch eine gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl einfach bis zweifach substituierte Alkylendioxy-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- oder sechsgliedrigen Ring bildet oder
- 25 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen ganz besonders bevorzugt für C₅-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl, worin zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für C₂-C₄-Alkandiyl oder C₂-C₄-Alkendiyl, worin jeweils gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder Butadiendiyl stehen,
- 30

- D steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₃-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₃-alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl,

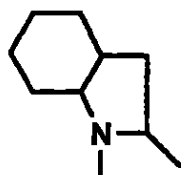
oder

- 10 A und D stehen gemeinsam ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl, worin gegebenenfalls ein Kohlenstoffatom durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls durch Methyl substituiert ist oder

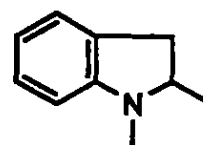
- 15 A und D stehen gemeinsam ganz besonders bevorzugt mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für eine der folgenden Gruppen AD:



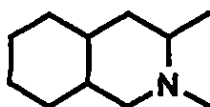
AD-1



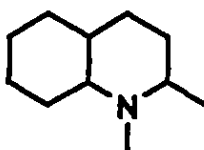
AD-2



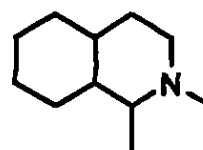
AD-3



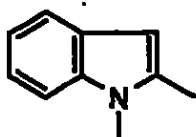
AD-4



AD-6

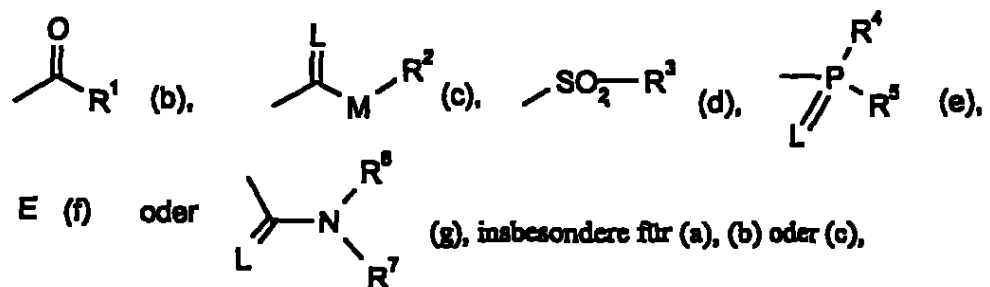


AD-8



AD-10

- G steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



in welchen

E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

5

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10 R¹ steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₂-alkyl oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl oder Methoxy substituiertes Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

15

für gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl,

20

für jeweils gegebenenfalls einfach durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiertes Thienyl oder Pyridyl,

R² steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₃-alkyl,

25

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl oder Methoxy substituiertes Cyclohexyl,

oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl,

5

R³ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, tert-Butyl, Methoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Cyano oder Nitro einfach substituiertes Phenyl,

10

R⁴ steht ganz besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Alkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkoxy, C₁-C₂-Fluoralkoxy, C₁-C₂-Alkylthio, C₁-C₂-Fluoralkylthio oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio,

15

R⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio,

20

R⁶ steht ganz besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy substituiertes Benzyl,

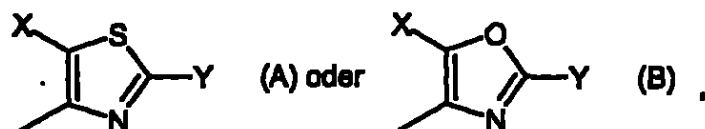
25

R⁷ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl oder Allyl oder

30

R⁶ und R⁷ stehen ganz besonders bevorzugt zusammen für einen C₅-C₆-Alkylest, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

Het steht hervorgehoben für

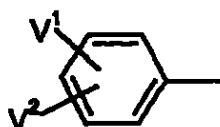


5

X steht hervorgehoben für Wasserstoff, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, oder iso-Propyl,

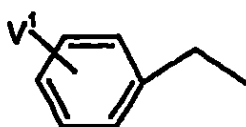
Y steht hervorgehoben für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl oder für die Gruppe

10



oder im Fall von Het = Thiazolyl ((I-1-A) bis (I-3-A)) auch für

15



V1 steht hervorgehoben für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Phenoxy, für gegebenenfalls durch Chlor oder Trifluormethyl substituiertes Phenyl,

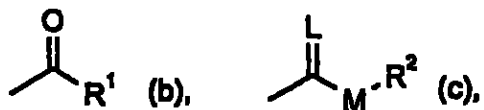
20

V2 steht hervorgehoben für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Trifluormethyl oder

25

V1 und V2 stehen zusammen hervorgehoben für -O-CH₂-O- oder -O-CF₂-O-,

- W steht hervorgehoben für N-D ⁽¹⁾, Sauerstoff ⁽²⁾ oder Schwefel ⁽³⁾,
- A steht hervorgehoben für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl oder Cyclopropyl,
- 5 B steht hervorgehoben für Wasserstoff oder Methyl oder
- A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen hervorgehoben für gesättigtes C₅-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach oder
- 10 zweifach durch Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Propoxy, Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist oder für C₅-C₆-Cycloalkyl, worin zwei nicht direkt benachbarte Kohlenstoffatome einen weiteren fünfgliedrigen Ring bilden,
- 15 D steht hervorgehoben für Wasserstoff,
- D steht hervorgehoben auch für i-Propyl,
- 20 A und D stehen zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind, hervorgehoben für Cyclohexyl, in welchem ein Ringatom durch Schwefel ersetzt sein kann,
- G steht hervorgehoben für Wasserstoff (a) oder im Fall von Het = Thiazolyl (I-1-A) bis (I-3-A) für eine der Gruppen
- 25



in welchen

L für Sauerstoff steht und

M für Sauerstoff steht,

5 R¹ steht hervorgehoben für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₂-alkyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl oder Methoxy substituiertes Cyclopropyl oder Cyclohexyl,

10 für gegebenenfalls einfach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, tert.-Butoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl,

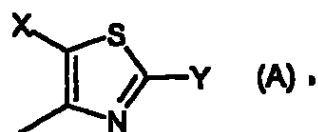
15 für jeweils gegebenenfalls einfach durch Chlor oder Methyl substituiertes Thienyl oder Pyridyl,

R² steht hervorgehoben für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₃-alkyl,

20 für gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl oder Methoxy substituiertes Cyclohexyl,

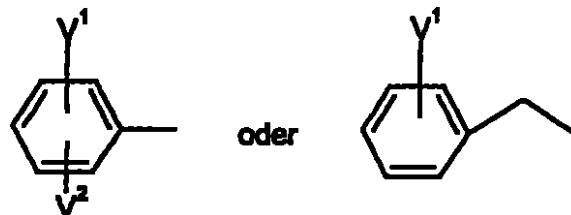
25 oder für jeweils gegebenenfalls einfach durch Fluor, Chlor, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl,

Het steht insbesondere bevorzugt für



X steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, Chlor oder Brom,

5 Y steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl oder für die Gruppen



in welcher

10

V¹ insbesondere bevorzugt für Wasserstoff, Brom, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Phenoxy oder t-Butyl oder für gegebenenfalls durch Chlor oder Trifluormethyl substituiertes Phenyl steht,

15 V² insbesondere bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Fluor oder Methoxy steht oder

V¹ und V² zusammen insbesondere bevorzugt für -O-CH₂-O- oder -O-CF₂-O- stehen.

20

W steht insbesondere bevorzugt für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3),

D steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff oder i-Propyl (speziell für Wasserstoff),

25

A steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl oder Cyclopropyl oder Wasserstoff (speziell für Methyl),

B steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl oder

5 A und B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen insbesondere bevorzugt für Cyclohexyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringatom durch Sauerstoff ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiert ist oder für Cyclohexyl, worin zwei nicht direkt benachbarte Kohlenstoffatome einen weiteren 5-gliedrigen C-Ring bilden,

10 A und D stehen insbesondere bevorzugt zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für Cyclohexyl, in welchem ein Ringatom durch Schwefel ersetzt sein kann,

15 G steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen

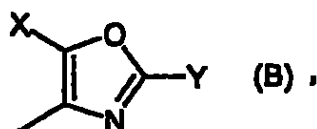


worin

20 R¹ insbesondere bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Chlor substituiertes Phenyl oder Pyridyl steht,

R² insbesondere bevorzugt für Methyl, Ethyl, Phenyl, Benzyl, n- oder i-Propyl steht.

25 Het steht insbesondere bevorzugt für



- X steht insbesondere bevorzugt für Methyl oder Ethyl,
- Y steht insbesondere bevorzugt für gegebenenfalls durch Chlor substituiertes Phenyl,
- 5 A steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl,
- B steht insbesondere bevorzugt für Methyl, oder
- 10 A und B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen gemeinsam insbesondere bevorzugt für Cyclohexyl, welches gegebenenfalls durch Methoxy oder Methyl substituiert ist,
- W steht insbesondere bevorzugt für N-D oder Sauerstoff,
- 15 D steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff,
- G steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff.
- 20 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen bzw. Erläuterungen können untereinander, also auch zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.
- 25 Erfindungsgemäß bevorzugt werden die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt (vorzugsweise) aufgeführten Bedeutungen vorliegt.
- 30 Erfindungsgemäß besonders bevorzugt werden die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt werden die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

5

Erfindungsgemäß hervorgehoben werden die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als hervorgehoben aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

10

Erfindungsgemäß insbesondere bevorzugt werden die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als insbesondere bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

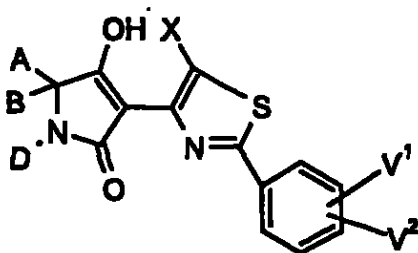
15

Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

20

Gegebenenfalls substituierte Reste können, sofern nichts anderes angegeben ist, einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

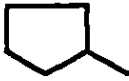
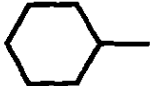
Im einzelnen seien beispielsweise außer den bei den Herstellungsbeispielen genannten Verbindungen die folgenden Verbindungen der Formel (I-1-a) genannt.



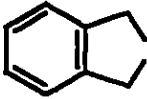
25

$X = CH_3$, $V^1 = 3-Cl$, $V^2 = H$.

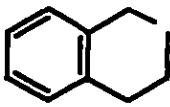
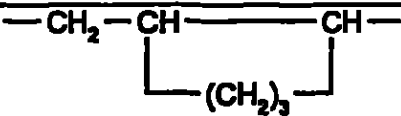
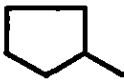
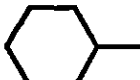
Tabelle 1:

A	B	D
CH ₃	H	H
C ₂ H ₅	H	H
C ₃ H ₇	H	H
i-C ₃ H ₇	H	H
C ₄ H ₉	H	H
i-C ₄ H ₉	H	H
s-C ₄ H ₉	H	H
t-C ₄ H ₉	H	H
CH ₃	CH ₃	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₃ H ₇	CH ₃	H
i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	CH ₃	H
	CH ₃	H
	CH ₃	
	-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₄ -	H
	-(CH ₂) ₅ -	H
	-(CH ₂) ₆ -	H

Fortsetzung Tabelle 1:

A	D	B
	$-(CH_2)_7-$	H
	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	H
	$-CH_2-O-(CH_2)_3-$	H
	$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$	H
	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	H
	$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$	H
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-(CH_2)_2-CH- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad CH_2 \end{array}$	H
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-CH_2- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad (CH_2)_4 \end{array}$	H
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-(CH_2)_2- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad (CH_2)_3 \end{array}$	H
		H

Fortsetzung Tabelle 1:

A	D	B
		H
	$-(CH_2)_3-$	H
	$-(CH_2)_4-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-CH_2-$	H
	$-CH_2-CH_2-CHCH_3-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-CHCH_3-$	H
	$-CH_2-S-CH_2-$	H
	$-CH_2-S-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-S-CH_2-$	H
		H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	$i-C_3H_7$	H
H		H
H		H
H		H
CH_3	CH_3	H
CH_3	C_2H_5	H
CH_3	C_3H_7	H
CH_3	$i-C_3H_7$	H

Fortsetzung Tabelle 1:

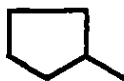
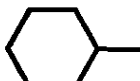
A	D	B
CH ₃		H
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

Tabelle 2: A, B und D wie in Tabelle 1 angegebenX = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.5 **Tabelle 3:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegebenX = CH₃; V¹ = 3-CF₃; V² = H.**Tabelle 4:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegebenX = CH₃; V¹ = 4-CF₃; V² = H.

10

Tabelle 5: A, B und D wie in Tabelle 1 angegebenX = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = 2-Cl.**Tabelle 6:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegebenX = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = 3-Cl.

15

Tabelle 7: A, B und D wie in Tabelle 1 angegebenX = CH₃; V¹ = 4-CH₃; V² = H.

- Tabelle 8:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 2\text{-Cl}$; $V^2 = 6\text{-OCH}_3$.
- 5 **Tabelle 9:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabelle 10:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- 10 **Tabelle 11:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabelle 12:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- 15 **Tabelle 13:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabelle 14:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 3\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- 20 **Tabelle 15:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabelle 16:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 3\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- 25 **Tabelle 17:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
 $X = \text{Cl}$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- 30

Tabelle 18: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben

X = Br, V¹ = 4-Cl; V² = H.

Tabelle 19: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben

X = C₂H₅; V¹ = 3-Cl; V² = 4-Cl.

Tabelle 20: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben

X = C₃H₇; V¹ = 3-Cl; V² = 4-Cl.

Tabelle 21: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben

X = CH₃; V¹ = 4-Br; V² = H.

Im einzelnen seien außer den bei den Herstellungsbeispielen genannten Verbindungen die folgenden Verbindungen der Formel (I-2-a) genannt:

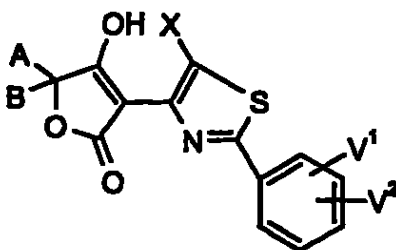
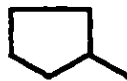
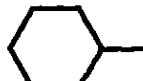


Tabelle 22: X = CH₃, V¹ = 3-Cl, V² = H.

A	B
CH ₃	H
C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	H
i-C ₃ H ₇	H
C ₄ H ₉	H
i-C ₄ H ₉	H
n-C ₄ H ₉	H

Fortsetzung Tabelle 22:

A	B
t-C ₄ H ₉	H
CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃
C ₃ H ₇	CH ₃
i-C ₃ H ₇	CH ₃
C ₄ H ₉	CH ₃
i-C ₄ H ₉	CH ₃
s-C ₄ H ₉	CH ₃
t-C ₄ H ₉	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
-(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₄ -	
-(CH ₂) ₅ -	
-(CH ₂) ₆ -	
-(CH ₂) ₇ -	
-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	
(CH ₂) ₂ -CHC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	

Fortsetzung Tabelle 22:

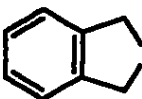
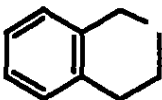
A	B
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-(CH_2)_2-CH- \\ \qquad \qquad \\ \text{---} CH_2 \text{---} \end{array}$	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-CH_2- \\ \qquad \qquad \\ \text{---} (CH_2)_4 \text{---} \end{array}$	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-(CH_2)_2- \\ \qquad \qquad \\ \text{---} (CH_2)_3 \text{---} \end{array}$	
	
	

Tabelle 23: A und B wie in Tabelle 22 angegeben $X = CH_3$; $V^1 = 4-Cl$; $V^2 = H$.5 **Tabelle 24:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben $X = CH_3$; $V^1 = 3-CF_3$; $V^2 = H$.

Tabelle 25: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.

5 **Tabelle 26:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = 2\text{-Cl}$.

Tabelle 27: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = 3\text{-Cl}$.

10

Tabelle 28: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-CH}_3$; $V^2 = \text{H}$.

15 **Tabelle 29:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 2\text{-Cl}$; $V^2 = 6\text{-OCH}_3$.

Tabelle 30: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

20 **Tabelle 31:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

Tabelle 32: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

25

Tabelle 33: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

30 **Tabelle 34:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.

Tabelle 35: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = C_3H_7$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.

5 **Tabelle 36:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = C_2H_5$; $V^1 = 3-CF_3$; $V^2 = H$.

Tabelle 37: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = C_3H_7$; $V^1 = 3-CF_3$; $V^2 = H$.

10 **Tabelle 38:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = Cl$; $V^1 = 4-Cl$; $V^2 = H$.

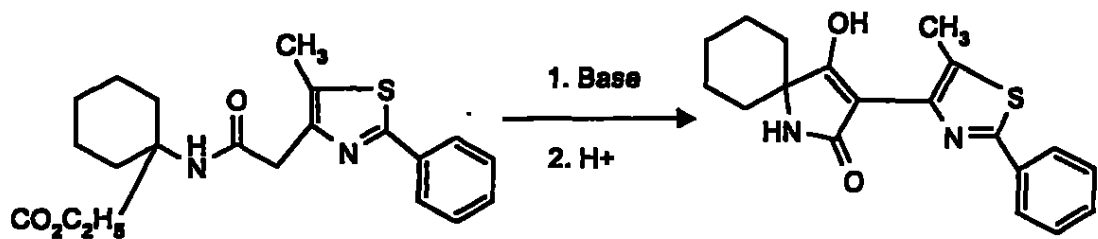
Tabelle 39: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = Br$; $V^1 = 4-Cl$; $V^2 = H$.

15 **Tabelle 40:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = C_2H_5$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = 4-Cl$.

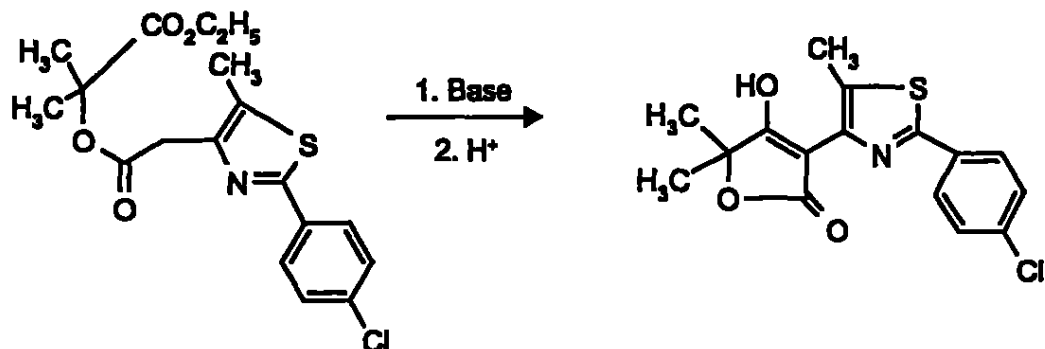
20 **Tabelle 41:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = C_3H_7$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = 4-Cl$.

Tabelle 42: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
 $X = CH_3$; $V^1 = 4-Br$; $V^2 = H$.

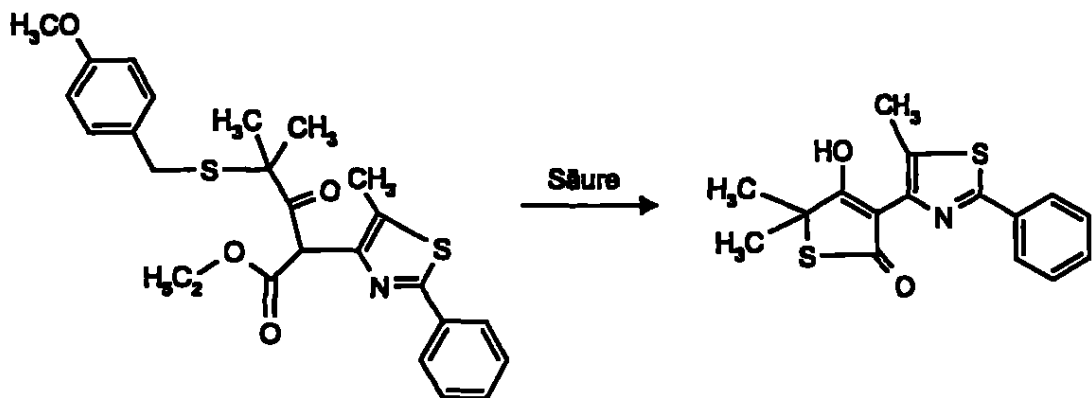
25 Verwendet man gemäß Verfahren (A) N-[4-(5-Methyl-2-phenyl)-thiazolylacetyl]-1-amino-cyclohexan-carbonsäureethylester als Ausgangsstoff, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



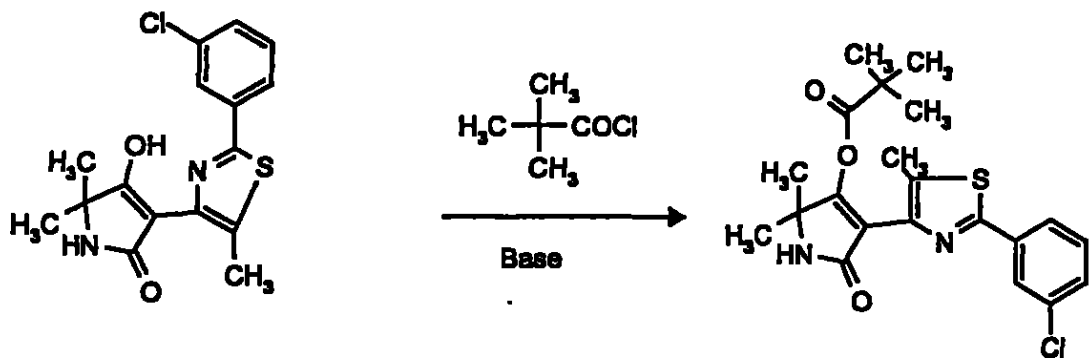
Verwendet man gemäß Verfahren (B) O-[4-(5-Methyl-2-(4-chlor)-phenyl)-thiazolyl acetyl]-2-hydroxyisobuttersäureethylester, so kann der Verlauf des erfindungsge-
 5 maßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



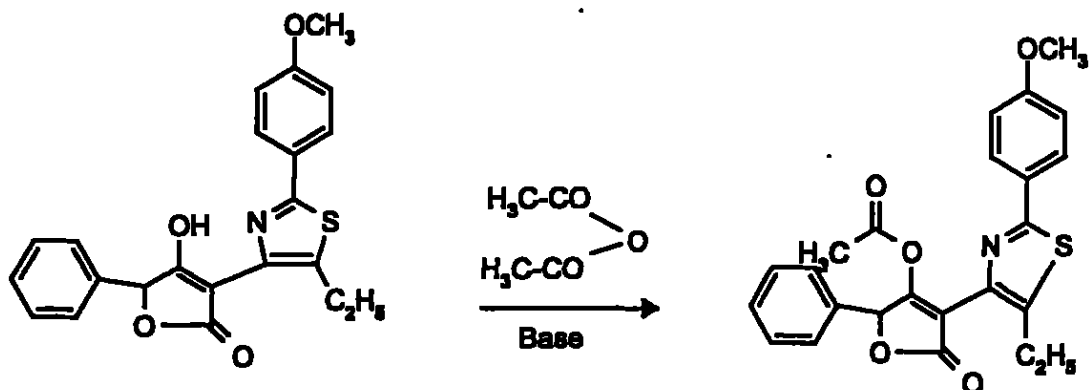
Verwendet man gemäß Verfahren (C) 2-[4-(5-Methyl-2-phenyl)-thiazolyl]-4-(4-methoxy)-benzylmercapto-4-methyl-3-oxo-valeriansäure-ethylester, so kann der Ver-
 10 lauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wieder-
 gegeben werden:



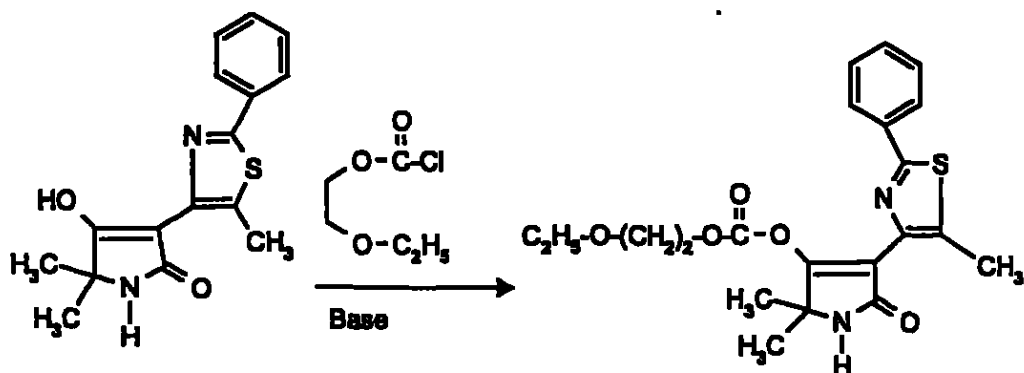
Verwendet man gemäß Verfahren (D α) 3-[4-(5-Methyl-2-(3-chlor-phenyl)-thiazo-
 15 lyl]-5,5-dimethylpyrrolidin-2,4-dion und Pivaloylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann
 der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema
 wiedergegeben werden:



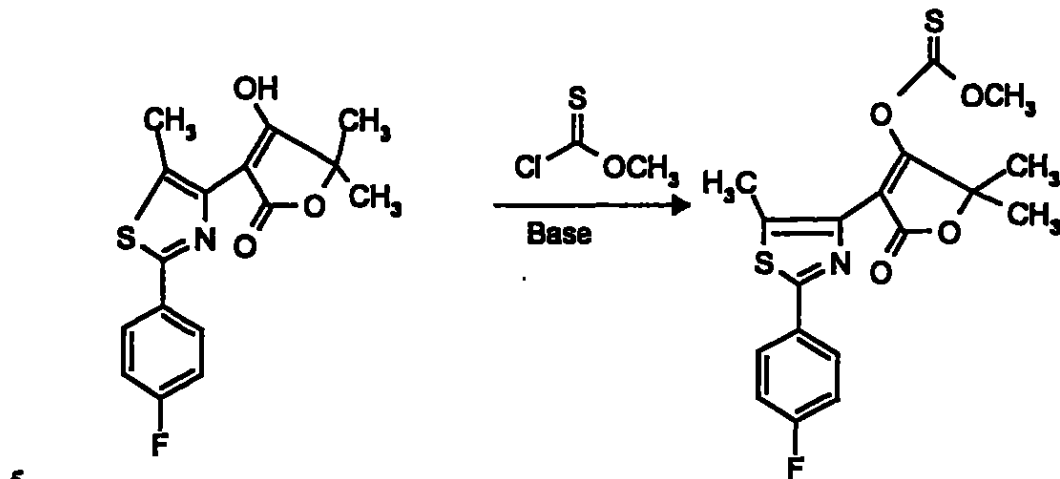
- 5 Verwendet man gemäß Verfahren (DB) 3-[4-(5-Ethyl-2-(4-methoxy-phenyl))-thiazolyl]-4-hydroxy-5-phenyl- Δ^3 -dihydrofuran-2-on und Acetanhydrid als Ausgangsverbindungen, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



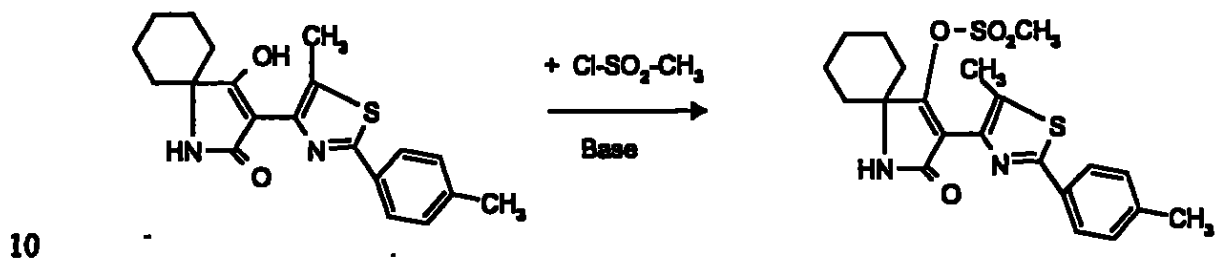
- 10 Verwendet man gemäß Verfahren (E) 3-[4-(5-Methyl-2-phenyl)-thiazolyl]-5,5-dimethylpyrrolidin-2,4-dion und Chlorameisensäureethoxyethylester als Ausgangsverbindungen, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



Verwendet man gemäß Verfahren (F), 3-[4-(5-Methyl-2-(4-fluor-phenyl))-thiazolyl]-4-hydroxy-5,5-dimethyl- Δ^3 -dihydrofuran-2-on und Chlormonothioameisensäuremethylester als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf folgendermaßen wiedergegeben werden:

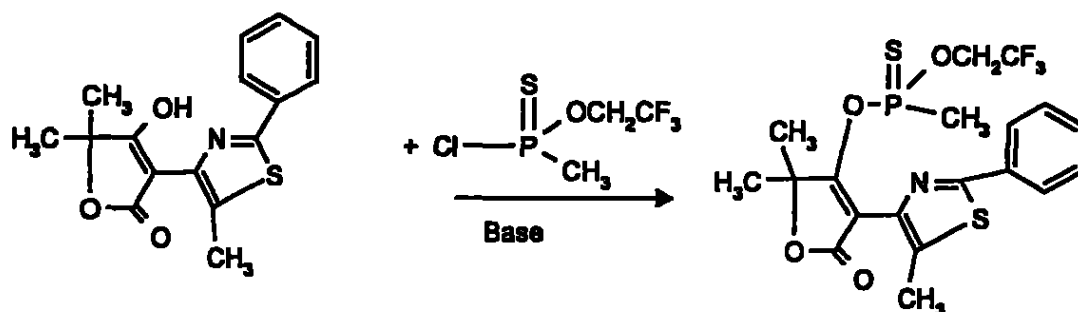


Verwendet man gemäß Verfahren (G) 3-[4-(5-Methyl-3-(4-methyl-phenyl))-thiazolyl]-5,5-pentamethylen-pyrrolidin-2,4-dion und Methansulfonsäurechlorid als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

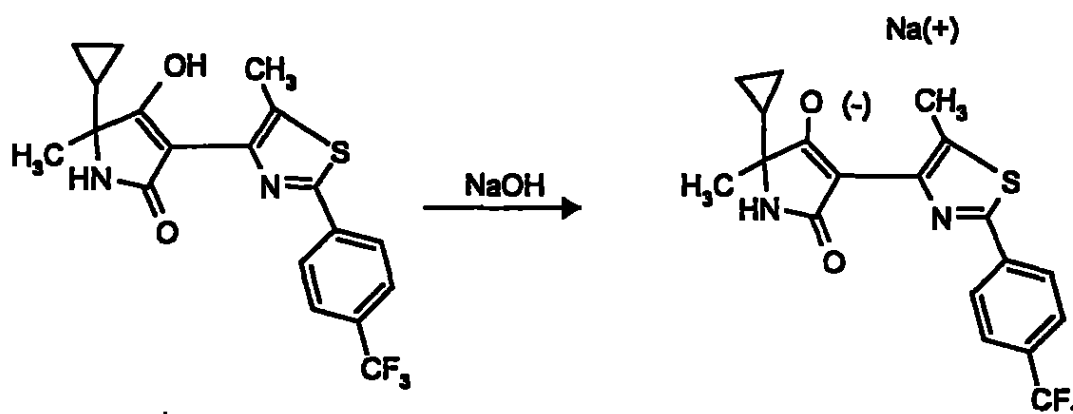


Verwendet man gemäß Verfahren (H) 3-[4-(5-Methyl-2-phenyl)-thiazolyl]-4-hydroxy-5,5-dimethyl- Δ^3 -dihydrofuran-2-on und Methanthio-phosphonsäurechlorid-(2,2,2-trifluorethylester) als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

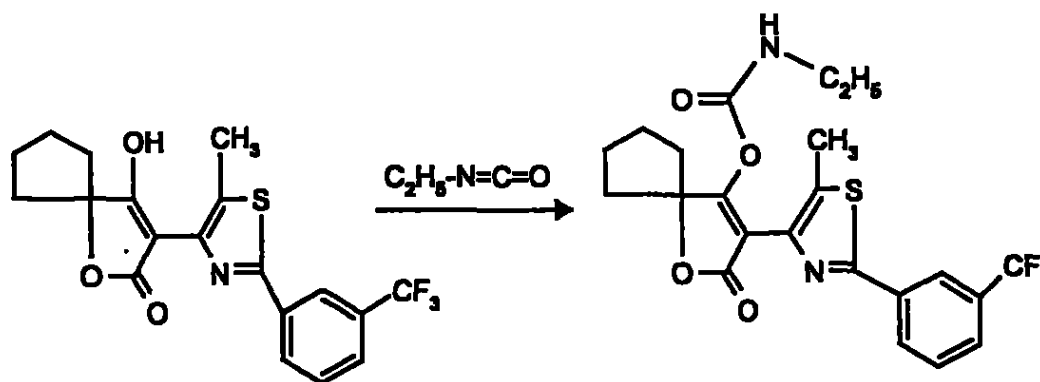
15



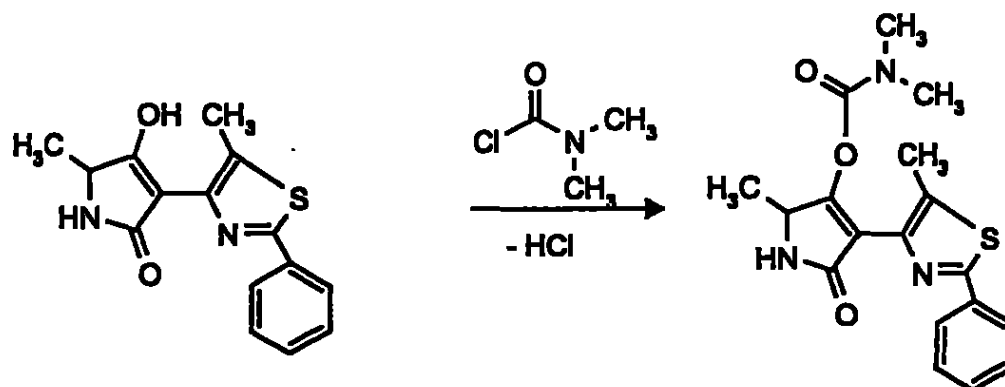
Verwendet man gemäß Verfahren (I) 3-[4-(5-Methyl-2-(4-trifluormethyl-phenyl))-thiazolyl]-5-cyclopropyl-5-methyl-pyrrolidin-2,4-dion und NaOH als Komponenten, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



Verwendet man gemäß Verfahren (Ja) 3-[4-(5-Methyl-2-(3-trifluormethyl-phenyl))-thiazolyl]-4-hydroxy-5-tetramethylen- Δ^3 -dihydro-furan-2-on und Ethylisocyanat als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

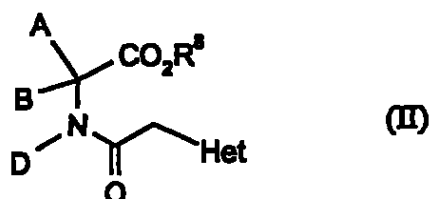


Verwendet man gemäß Verfahren (JB) 3-[4-(5-Methyl-2-phenyl)-thiazolyl]-5-methyl-pyrrolidin-2,4-dion und Dimethylcarbamidsäurechlorid als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Schema wiedergegeben werden:



5

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (II)



in welcher

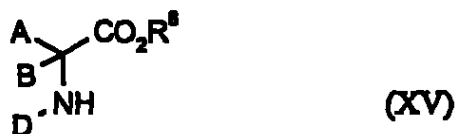
10

A, B, D, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

sind neu.

15

Man erhält die Acylaminosäureester der Formel (II) beispielsweise, wenn man Aminosäurederivate der Formel (XV)

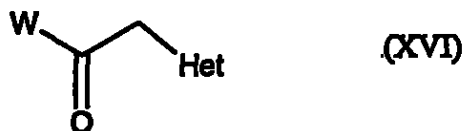


in welcher

20

A, B, R⁸ und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit substituierten Hetarylessigsäurederivaten der Formel (XVI)



5

in welcher

Het die oben angegebene Bedeutung hat und

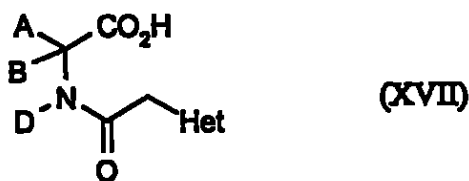
10 W für eine durch Carbonsäureaktivierungsreagenzien wie Carbonyldiimidazol, Carbonyldiimide (wie z.B. Dicyclohexylcarbodiimid), Phosphorylierungsreagenzien (wie z.B. POCl₃, BOP-Cl), Halogenierungsmittel z.B. Thionylchlorid, Oxalylchlorid, Phosgen oder Chlorameisensäureester eingeführte Abgangsgruppe steht

15

acyliert (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968)

oder wenn man Acylaminosäuren der Formel (XVII)

20



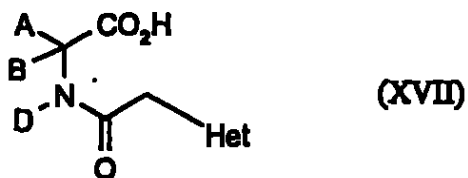
in welcher

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

verestert (Chem. Ind. (London) 1568 (1968)).

Die Verbindungen der Formel (XVII)



in welcher

5

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

sind neu.

10

Man erhält die Verbindungen der Formel (XVII), wenn man Aminosäuren der Formel (XVIII)



in welcher

15

A, B und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit substituierten Hetarylessigsäurederivaten der Formel (XVI)



20

in welcher

W und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

beispielsweise nach Schotten-Baumann acyliert (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, S. 505).

Die Verbindungen der Formel (XVI) sind teilweise neu. Sie lassen sich nach im
5 Prinzip bekannten Verfahren darstellen (s. z.B. H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. 8, S. 467-469 (1952)).

Man erhält die Verbindungen der Formel (XVI) beispielsweise, indem man substitu-
10 ierte Hetarylessigsäuren der Formel (XIX)



in welcher

X und Y die oben angegebene Bedeutung haben,

15

mit Halogenierungsmitteln (z.B. Thionylchlorid, Thionylbromid, Oxalylchlorid, Phosgen, Phosphortrichlorid, Phosphortribromid oder Phosphorpentachlorid) gegeben-
nenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. gegebenenfalls chlorierten ali-
phatischen oder aromatischen Kohlenwasserstoffen wie Toluol oder Methylenchlo-
20 rid) bei Temperaturen von -20°C bis 150°C, bevorzugt von -10°C bis 100°C, umgesetzt.

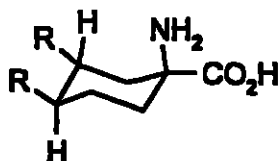
Die Hetarylessigsäuren der Formel (XIX) sind teilweise käuflich, teilweise bekannt
oder lassen sich nach im Prinzip bekannten Verfahren herstellen

- 25 a) Thiazolylessigsäuren: C.S. Rooney et al. J. Med. Chem. 26, 700-714 (1983); EP-A-368 592; M.S. Malamas et al. J. Med. Chem. 39, 237-246 (1996); J. L. Collins et al. J. Med. Chem. 41, 5037-5054 (1998); NL-A-66 14 130;
- b) Oxazolylessigsäuren: K. Meguro et al., Chem. Pharm. Bull. 34, 2840-2851 (1986), M. Schi et al., Chem. Pharm. Bull. 36, 4435-4440 (1988), Malmas et

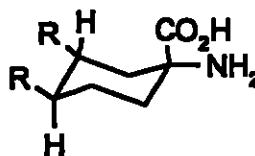
al., J. Med. Chem. 39, 237-245 (1996), EP 0 177 353 A2, WO 87/03 807, WO 95/18 125, B. Hulin, J. Med. Chem. 35, 1853-1864 (1992), EP 0 389 699 A 1.

- 5 Die Verbindungen der Formel (XV) und (XVIII) sind teilweise käuflich und/oder bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren darstellen (siehe z.B. Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14] 5, S. 11-22, 23-27 (1970)).

- 10 Die substituierten cyclischen Aminocarbonsäuren der Formel (XVIIIa), in der A und B einen Ring bilden, sind im allgemeinen nach der Bucherer-Bergs-Synthese oder nach der Strecker-Synthese erhältlich und fallen dabei jeweils in unterschiedlichen Isomerenformen an. So erhält man unter den Bedingungen der Bucherer-Bergs-Synthese vorwiegend die Isomeren (im folgenden der Einfachheit halber als β bezeichnet), in welchen die Reste R und die Carboxylgruppe Äquatorial stehen, während
15 nach den Bedingungen der Strecker-Synthese vorwiegend die Isomeren (im folgenden der Einfachheit halber als α bezeichnet) anfallen, bei denen die Aminogruppe und die Reste R Äquatorial stehen.



20 Bucherer-Bergs-Synthese
(β -Isomeres)

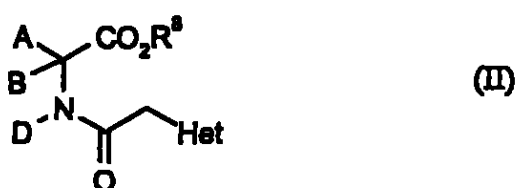


Strecker-Synthese
(α -Isomeres)

(L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J.T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975).

25

Weiterhin lassen sich die bei dem obigen Verfahren (A) verwendeten Ausgangsstoffe der Formel (II)



in welcher

A, B, D, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

herstellen, wenn man Aminonitrile der Formel (XX)



in welcher

10

A, B und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit substituierten Hetarylessigsäurederivaten der Formel (XVI)

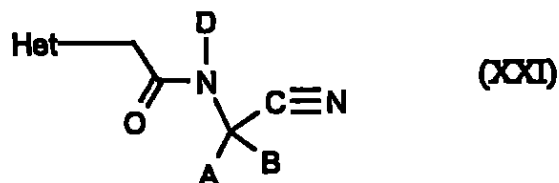


in welcher

W und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

zu Verbindungen der Formel (XXI)



in welcher

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

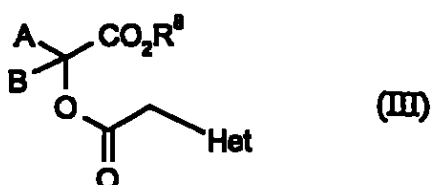
umsetzt

5

und diese anschließend einer sauren Alkoholyse unterwirft.

Die Verbindungen der Formel (XXI) sind ebenfalls neu.

10 Die bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (B) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (III)



in welcher

15

A, B, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

sind neu.

20 Sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen.

So erhält man die Verbindungen der Formel (III) beispielsweise, wenn man

2-Hydroxycarbonsäureester der Formel (XXII)

25



in welcher

A, B und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit substituierten Hetarylessigsäurederivaten der Formel (XVI)

5



in welcher

W und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

acyliert (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953).

Weiterhin erhält man Verbindungen der Formel (III), wenn man

15

substituierte Hetarylessigsäuren der Formel (XIX)



in welcher

20

Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit α -Halogencarbonsäureestern der Formel (XXIII)



25

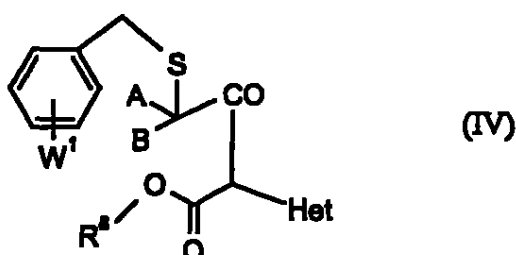
in welcher

A, B und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Chlor oder Brom steht,

5 alkyliert.

Die bei dem obigen Verfahren (C) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (IV)



10

in welcher

A, B, W¹, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben, und

15 W¹ für Wasserstoff, Halogen, Alkyl (bevorzugt C₁-C₆-Alkyl) oder Alkoxy (bevorzugt C₁-C₆-Alkoxy) steht,

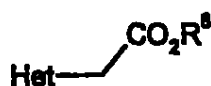
sind neu.

20 Sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen.

Man erhält die Verbindungen der Formel (IV) beispielsweise, wenn man

Verbindungen der Formel (XXIV)

25



(XXIV)

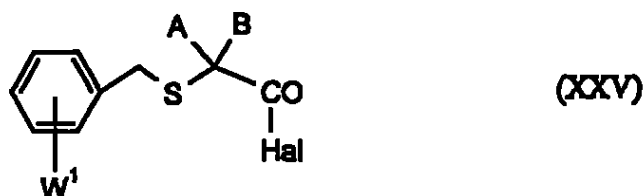
42

- 71 -

in welcher

Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 mit 2-Benzylthio-carbonsäurehalogeniden der Formel (XXV)



in welcher

10 A, B und W¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht,

15 in Gegenwart von starken Basen acyliert (siehe z.B. M.S. Chambers, B.J. Thomas, D.J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228).

Die Verbindungen der Formel (XXIV) sind teilweise käuflich, teilweise bekannt oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen:

- 20 a) Thiazolylessigsäureester: C.S. Rooney et al., J. Med. Chem. 26, 700-714 (1983), EP-A-368 592, M.S. Mahmas et al., J. Med. Chem. 39, 237-246 (1996); J. C. Collins et al., J. Med. Chem. 41, 5037-5054 (1998); NL-A-6 614 130.
- 25 b) Oxazolylessigsäuren: K. Meguro et al., Chem. Pharm. Bull. 34, 2840-2851 (1986), M. Sehi et al., Chem. Pharm. Bull. 36, 4435-4440 (1988), Mahmas et al., J. Med. Chem. 39, 237-245 (1996), EP 0 177 353 A2, WO 87/03 807, WO 95/18 125, B. Hulin, J. Med. Chem. 35, 1853-1864 (1992), EP 0 389 699 A 1.

Die zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (D), (E), (F), (G), (H), (I) und (J) außerdem als Ausgangsstoffe benötigten Säurehalogenide der Formel (V), Carbonsäureanhydride der Formel (VI), Chlorameisensäureester oder Chlorameisensäurethioester der Formel (VII), Chlormonothioameisensäureester oder Chlordithioameisensäureester der Formel (VIII), Sulfonsäurechloride der Formel (IX), Phosphorverbindungen der Formel (X) und Metallhydroxide, Metallalkoxide oder Amine der Formel (XI) und (XII) und Isocyanate der Formel (XIII) und Carbamidsäurechloride der Formel (XIV) sind allgemein bekannte Verbindungen der Organischen bzw. Anorganischen Chemie.

10

Die Verbindungen der Formeln (XV), (XVIII), (XX), (XXII), (XXIII) und, (XXV), sind teilweise künstlich, teilweise bekannt und/oder lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen.

15

Das Verfahren (A) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (II), in welcher A, B, D, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart einer Base einer intramolekularen Kondensation unterwirft.

20

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (A) alle inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methylpyrrolidon, sowie Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Iso-Propanol, Butanol, Iso-Butanol und tert.-Butanol.

25

Als Base (Deprotonierungsmittel) können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) alle üblichen Protonenakzeptoren eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, -hydroxide und -carbonate, wie Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Magnesiumoxid, Calciumoxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat, die auch in Gegenwart von

30

x8

Phasentransferkatalysatoren wie z.B. Triethylbenzylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Adogen 464 (= Methyltrialkyl(C₈-C₁₀)ammoniumchlorid) oder TDA 1 (= Tris-(methoxyethoxyethyl)-amin) eingesetzt werden können. Weiterhin können Alkalimetalle wie Natrium oder Kalium verwendet werden. Ferner sind

5 Alkalimetall- und Erdalkalimetallamide und -hydride, wie Natriumamid, Natriumhydrid und Calciumhydrid, und außerdem auch Alkalimetallalkoholate, wie Natrium-methylat, Natrium-ethylat und Kalium-tert.-butylat einsetzbar.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen

10 arbeitet man bei Temperaturen zwischen -80°C und 180°C, vorzugsweise zwischen -50°C und 120°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (A) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

15

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) setzt man die Reaktionskomponenten der Formel (II) und die deprotonierenden Basen im allgemeinen in etwa doppeltäquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder

20 andere Komponente in einem größeren Überschuss (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

Das Verfahren (B) ist dadurch gekennzeichnet, dass Verbindungen der Formel (III), in welcher A, B, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base einer intramolekularen

25 Kondensation unterwirft.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (B) alle inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare

30 Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methyl-

pyrrolidon. Weiterhin können Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Iso-Propanol, Butanol, Iso-Butanol und tert.-Butanol eingesetzt werden.

5 Als Base (Deprotonierungsmittel) können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) alle üblichen Protonenakzeptoren eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, -hydroxide und -carbonate, wie Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Magnesiumoxid, Calciumoxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat, die auch in Gegenwart von Phasentransferkatalysatoren wie z.B. Triethylbenzylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Adogen 464 (= Methyltrialkyl(C₈-C₁₀)ammoniumchlorid) oder
10 TDA 1 (= Tris-(methoxyethoxyethyl)-amin) eingesetzt werden können. Weiterhin können Alkalimetalle wie Natrium oder Kalium verwendet werden. Ferner sind Alkalimetall- und Erdalkalimetallamide und -hydride, wie Natriumamid, Natriumhydrid und Calciumhydrid, und außerdem auch Alkalimetallalkoholate, wie Natrium-methylat, Natrium-ethylat und Kalium-tert.-butylat einsetzbar.
15

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -80°C und 180°C, vorzugsweise zwischen
20 -50°C und 120°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (B) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

25 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man die Reaktionskomponenten der Formel (III) und die deprotonierenden Basen im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuss (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

30 Das Verfahren (C) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (IV) in welcher A, B, Het und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben, in Gegen-

wart einer Säure und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels intramolekular cyclisiert.

5 Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (C) alle inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan, Chloroform, Ethylenchlorid, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methyl-pyrrolidon. Weiterhin können Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, 10 iso-Propanol, Butanol, Isobutanol, tert.-Butanol eingesetzt werden.

Gegebenenfalls kann auch die eingesetzte Säure als Verdünnungsmittel dienen.

15 Als Säure können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (C) alle üblichen anorganischen und organischen Säuren eingesetzt werden wie z.B. Halogenwasserstoffsäuren, Schwefelsäure, Alkyl-, Aryl- und Haloalkylsulfonsäuren, insbesondere halogenierte Alkylcarbonsäuren wie z.B. Trifluoressigsäure.

20 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -30°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C.

25 Das erfindungsgemäße Verfahren (C) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) setzt man die Reaktionskomponenten der Formeln (IV) und die Säure z.B. in äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch gegebenenfalls auch möglich, die Säure als Lösungsmittel oder als 30 Katalysator zu verwenden.

Das Verfahren (D- α) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) jeweils mit Carbonsäurehalogeniden der Formel (V) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

5

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (D- α) alle gegenüber den Säurehalogeniden inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüber hinaus Carbonsäureester, wie Ethylacetat, Nitrile wie Acetonitril und auch stark polare Solventien, wie Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid und Sulfolan. Wenn die Hydrolysestabilität des Säurehalogenids es zulässt, kann die Umsetzung auch in Gegenwart von Wasser durchgeführt werden.

15

Als Säurebindemittel kommen bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (D- α) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicycloundecen (DBU), Diazabicyclononen (DBN), Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calciumoxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalihydroxide wie Natriumhydroxid und Kaliumhydroxid.

25

Die Reaktionstemperaturen können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (D- α) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.

30

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D- α) werden die Ausgangsstoffe der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) und das Carbonsäurehalogenid der

Formel (V) im allgemeinen jeweils in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäurehalogenid in einem größeren Überschuss (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

- 5 Das Verfahren (D-β) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) mit Carbonsäureanhydriden der Formel (VI) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.
- 10 Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (D-β) vorzugsweise diejenigen Verdünnungsmittel verwendet werden, die auch bei der Verwendung von Säurehalogeniden vorzugsweise in Betracht kommen. Im übrigen kann auch ein im Überschuss eingesetztes Carbonsäureanhydrid gleichzeitig als Verdünnungsmittel fungieren.
- 15 Als gegebenenfalls zugesetzte Säurebindemittel kommen beim Verfahren (D-β) vorzugsweise diejenigen Säurebindemittel in Frage, die auch bei der Verwendung von Säurehalogeniden vorzugsweise in Betracht kommen.
- 20 Die Reaktionstemperaturen können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (D-β) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.
- 25 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D-β) werden die Ausgangsstoffe der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) und das Carbonsäureanhydrid der Formel (VI) im allgemeinen in jeweils angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäureanhydrid in einem größeren Überschuss (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.
- 30 Im allgemeinen geht man so vor, dass man Verdünnungsmittel und im Überschuss vorhandenes Carbonsäureanhydrid sowie die entstehende Carbonsäure durch Destil-

lation oder durch Waschen mit einem organischen Lösungsmittel oder mit Wasser entfernt.

5 Das Verfahren (E) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) jeweils mit Chlorameisensäureestern oder Chlorameisensäurethiolester der Formel (VII) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

10 Als Säurebindemittel kommen bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (E) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, DABCO, DBU, DBA, Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calciumoxid, außerdem Alkali- und Erdalkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalihydroxide wie Natriumhydroxid
15 und Kaliumhydroxid.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (E) alle gegenüber den Chlorameisensäureestern bzw. Chlorameisensäurethiolester inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenwasserstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüber hinaus Carbonsäureester, wie Ethylacetat, Nitrile wie Acetonitril und auch stark polare Solventien, wie
20 Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid und Sulfolan.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Arbeitet man in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und eines Säurebindemittels, so liegen die
30 Reaktionstemperaturen im allgemeinen zwischen -20°C und +100°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 50°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (E) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

- 5 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) werden die Ausgangsstoffe der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) und der entsprechende Chlorameisensäure-
ester bzw. Chlorameisensäurethiolester der Formel (VII) im allgemeinen jeweils in
angenähernt äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, die eine
oder andere Komponente in einem größeren Überschuss (bis zu 2 Mol) einzusetzen.
10 Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen geht man so vor,
dass man ausgefallene Salze entfernt und das verbleibende Reaktionsgemisch durch
Abziehen des Verdünnungsmittels einengt.

- Das erfindungsgemäße Verfahren (F) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbin-
15 dungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) jeweils mit Verbindungen der Formel
(VIII) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart
eines Säurebindemittels umsetzt.

- Beim Herstellungsverfahren (F) setzt man pro Mol Ausgangsverbindung der For-
20 meln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) ca. 1 Mol Chlormonothioameisensäureester bzw. Chlor-
dithioameisensäureester der Formel (VIII) bei 0 bis 120°C, vorzugsweise bei 20 bis
60°C um.

- Als gegebenenfalls zugesetzte Verdünnungsmittel kommen alle inerten polaren or-
25 ganischen Lösungsmittel in Frage, wie Nitrile, Ester, Ether, Amide, Sulfone, Sulf-
oxide, aber auch Halogenalkane.

- Vorzugsweise werden Acetonitril, Essigsäureethylester, Dimethylsulfoxid, Tetra-
30 hydrofuran, Dimethylformamid oder Methylenchlorid eingesetzt.

Stellt man in einer bevorzugten Ausführungsform durch Zusatz von starken Deprotonierungsmitteln wie z.B. Natriumhydrid oder Kaliumtertiärbutylat das Enolatsalz der Verbindungen (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) dar, kann auf den weiteren Zusatz von Säurebindemitteln verzichtet werden.

5

Werden Säurebindemittel eingesetzt, so kommen übliche anorganische oder organische Basen in Frage, beispielhaft seien Natriumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Pyridin, Triethylamin aufgeführt.

10

Die Reaktion kann bei Normaldruck oder unter erhöhtem Druck durchgeführt werden, vorzugsweise wird bei Normaldruck gearbeitet. Die Aufarbeitung geschieht nach üblichen Methoden.

15

Das erfindungsgemäße Verfahren (G) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) jeweils mit Sulfonsäurechloriden der Formel (IX) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

20

Beim Herstellungsverfahren (G) setzt man pro Mol Ausgangsverbindung der Formel (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) ca. 1 Mol Sulfonsäurechlorid der Formel (IX) bei -20 bis 150°C, vorzugsweise bei 20 bis 70°C um.

25

Als gegebenenfalls zugesetzte Verdünnungsmittel kommen alle inerten polaren organischen Lösungsmittel in Frage wie Nitrile, Ester, Ether, Amide, Sulfone, Sulfoxide oder halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid.

30

Vorzugsweise werden Acetonitril, Essigsäureethylester, Dimethylsulfoxid, Tetrahydrofuran, Dimethylformamid, Methylenchlorid eingesetzt.

Stellt man in einer bevorzugten Ausführungsform durch Zusatz von starken Deprotonierungsmitteln (wie z.B. Natriumhydrid oder Kaliumtertiärbutylat) das Enolatsalz

der Verbindungen (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) dar, kann auf den weiteren Zusatz von Säurebindemitteln verzichtet werden.

5 Werden Säurebindemittel eingesetzt, so kommen übliche anorganische oder organische Basen in Frage, beispielhaft seien Natriumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Pyridin, Triethylamin aufgeführt.

Die Reaktion kann bei Normaldruck oder unter erhöhtem Druck durchgeführt werden, vorzugsweise wird bei Normaldruck gearbeitet. Die Aufarbeitung geschieht
10 nach üblichen Methoden.

Das erfindungsgemäße Verfahren (H) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) jeweils mit Phosphorverbindungen der Formel (X) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.
15

Beim Herstellungsverfahren (H) setzt man zum Erhalt von Verbindungen der Formeln (I-1-A-e) bis (I-3-B-e) auf 1 Mol der Verbindungen (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), 1 bis 2, vorzugsweise 1 bis 1,3 Mol der Phosphorverbindung der Formel (X) bei Temperaturen zwischen -40°C und 150°C, vorzugsweise zwischen -10 und 110°C um.
20

Als gegebenenfalls zugesetzte Verdünnungsmittel kommen alle inerten, polaren organischen Lösungsmittel in Frage wie Ether, Amide, Nitrile, Alkohole, Sulfide, Sulfone, Sulfoxide etc.
25

Vorzugsweise werden Acetonitril, Dimethylsulfoxid, Tetrahydrofuran, Dimethylformamid, Methylenchlorid eingesetzt.

Als gegebenenfalls zugesetzte Säurebindemittel kommen übliche anorganische oder organische Basen in Frage wie Hydroxide, Carbonate oder Amine. Beispielhaft seien
30

Natriumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Pyridin, Triethylamin aufgeföhrt.

5 Die Umsetzung kann bei Normaldruck oder unter erhöhtem Druck durchgeführt werden, vorzugsweise wird bei Normaldruck gearbeitet. Die Aufarbeitung geschieht nach üblichen Methoden der organischen Chemie. Die Reinigung der anfallenden Endprodukte geschieht vorzugsweise durch Kristallisation, chromatographische Reinigung oder durch sogenanntes "Andestillieren", d.h. Entfernung der flüchtigen Bestandteile im Vakuum.

10

Das Verfahren (I) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) mit Metallhydroxiden bzw. Metallalkoxiden der Formel (XI) oder Aminen der Formel (XII), gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umsetzt.

15

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (I) vorzugsweise Ether wie Tetrahydrofuran, Dioxan, Diethylether oder aber Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, aber auch Wasser eingesetzt werden.

20

Das erfindungsgemäße Verfahren (I) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Die Reaktionstemperaturen liegen im allgemeinen zwischen -20°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 50°C.

25

Das erfindungsgemäße Verfahren (J) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) jeweils (J- α) mit Verbindungen der Formel (XIII) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oder (J- β) mit Verbindungen der Formel (XIV) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

30

Bei Herstellungsverfahren (J- α) setzt man pro Mol Ausgangsverbindung der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) ca. 1 Mol Isocyanat der Formel (XIII) bei 0 bis 100°C, vorzugsweise bei 20 bis 50°C um.

5

Als gegebenenfalls zugesetzte Verdünnungsmittel kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Frage, wie Ether, Amide, Nitrile, Sulfone, Sulfoxide.

10

Gegebenenfalls können Katalysatoren zur Beschleunigung der Reaktion zugesetzt werden. Als Katalysatoren können sehr vorteilhaft zinnorganische Verbindungen, wie z.B. Dibutylzinndilaurat eingesetzt werden. Es wird vorzugsweise bei Normaldruck gearbeitet.

15

Beim Herstellungsverfahren (J- β) setzt man pro Mol Ausgangsverbindung der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) ca. 1 Mol Carbamidsäurechlorid der Formel (XIV) bei -20 bis 150°C, vorzugsweise bei 0 bis 70°C um.

20

Als gegebenenfalls zugesetzte Verdünnungsmittel kommen alle inerten polaren organischen Lösungsmittel in Frage wie Nitrile, Ester, Ether, Amide, Sulfone, Sulfoxide oder halogenierte Kohlenwasserstoffe.

Vorzugsweise werden Acetonitril, Essigsäureethylester, Dimethylsulfoxid, Tetrahydrofuran, Dimethylformamid oder Methylenchlorid eingesetzt.

25

Stellt man in einer bevorzugten Ausführungsform durch Zusatz von starken Deprotonierungsmitteln (wie z.B. Natriumhydrid oder Kaliumtertiärbutylat) das Enolatsalz der Verbindung (I-1-A-a) bis (I-3-B-a) dar, kann auf den weiteren Zusatz von Säurebindemitteln verzichtet werden.

Werden Säurebindemittel eingesetzt, so kommen übliche anorganische oder organische Basen in Frage, beispielhaft seien Natriumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Triethylamin oder Pyridin genannt.

- 5 Die Reaktion kann bei Normaldruck oder unter erhöhtem Druck durchgeführt werden, vorzugsweise wird bei Normaldruck gearbeitet. Die Aufarbeitung geschieht nach üblichen Methoden.

- 10 Die Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den
15 oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

- 20 Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp..

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera* spp..

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

- 25 Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp..

- 30 Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinea* spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Harcinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella accidentalis*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

- 5 Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.
- 10

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.

15

20

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizophorthera dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiornhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllodes*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*, *Lissorhoptrus oryzophilus*.

25

30

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

- 5 Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*, *Hylemyia* spp., *Liriomyza* spp..

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..

- 10 Aus der Klasse der Arachnida z.B. *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*, *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp.,
15 *Hemitarsonemus* spp., *Brevipalpus* spp..

- Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp., *Globodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp.,
20 *Trichodorus* spp., *Bursaphelenchus* spp..

- Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch als Herbizide und Mikrobizide, beispielsweise als Fungizide, Antimykotika und Bakterizide verwendet werden. Sie
25 lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

- Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie
30 erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die

durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützba-
ren oder nicht schützba-
5 Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungs-
10 material, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

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

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

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen
30 oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende

Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der Formel (I) behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Mischungen.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

5

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln.

10

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

15

20

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-

25

30

Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate; als Dispergiemittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

5 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

10

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

20

Der erfindungsgemäße Wirkstoff kann in seinen handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

25

Besonders günstige Mischpartner sind z.B. die folgenden:

Fungizide:

30

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

- Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloro-
5 picrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon,
10 Dodemorph, Dodine, Drazoxolon, Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol, Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenspiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol,
15 Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumecycloz, Guazatin, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,
20 Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione, Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupferasphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und
25 Bordeaux-Mischung, Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomyacin, Myclobutanil, Myclozolin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,
30 Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthin,

- Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin,
 Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb,
 Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil,
 Pyroquilon, Pyroxyfur,
 5 Quinconazol, Quintozen (PCNB),
 Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,
 Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol,
 Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl,
 Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol,
 10 Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
 Uniconazol,
 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,
 Zarilamid, Zineb, Ziram sowie
 Dagger G,
 15 OK-8705,
 OK-8801,
 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 20 α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-
 triazol-1-ethanol,
 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,
 (E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
 {2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-
 25 isopropylester
 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
 30 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,

- 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropanecarboxamid,
 5 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
 10 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
 2-Aminobutan,
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
 15 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyantomethyl)-acetamid,
 2-Phenylphenol(OPP),
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
 20 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
 8-Hydroxychinolinsulfat,
 25 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-hydrochlorid,
 30 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
 Kaliumhydrogencarbonat,

- Methantetrathiol-Natriumsalz,
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
 5 N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 10 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
 15 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioat,
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
 20
- Bakterizide:**
- Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,
 Oethilnon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Teclofta-
 lam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.
- 25
- Insektizide / Akarizide / Nematizide:**
- Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,
 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,
 Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,
 30 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis,
 Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb,

- Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,
- Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap,
- 5 Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine, Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon,
- 10 Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopffthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocab, Fenoxacrim,
- 15 Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocylthrin, Flucyclohexuron, Flucylthrin, Flufenoxuron, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocab, Granuloseviren
- 20 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene, Imidacloprid, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin, Kampolyederviren
- Lambda-cyhalothrin, Lufenuron
- Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
- 25 Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocab, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos, Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron
- Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M
- Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat,
- 30 Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine,

- Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen,
Pyriproxyfen,
Quinalphos,
Ribavirin
- 5 Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos,
Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,
Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-
cypermethrin, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen
oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin,
- 10 Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon,
Triflumuron, Trimethacarb,
Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii
YI 5302
Zeta-cypermethrin, Zolaprofos
- 15 (1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-
furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat
(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat
1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-
imin
- 20 2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol
2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
3-Methylphenyl-propylcarbamate
- 25 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-
3(2H)-pyridazinon
4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-
pyridazinon
- 30 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorophenyl)-3(2H)-pyridazinon
Bacillus thuringiensis strain EG-2348

- Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid
 Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-
 ester
 [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
 5 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd
 Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat
 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin
 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-
 1-carboxamid
 10 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin
 N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid
 N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat
 15 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit
 Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in
 ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen
 20 bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten
 sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne dass
 der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten An-
 25 wendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der
 Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise
 zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen
 30 Weise.

Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekalkten Unterlagen aus.

- 5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räude milben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:
- 10 Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp..
- Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp.,
- 15 *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp..
- Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp.,
- (20 *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp..
- Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp.,
- 25 *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp..
- Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp..
- Aus der Ordnung der Blattellida z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp..
- 30 Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp.,

Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

- 5 Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

10

- Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische
15 sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

20

- Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen
25 (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitoneal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw.
- 30

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad
5 verwenden.

Außerdem wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.

10 Beispielhaft und vorzugsweise - ohne jedoch zu limitieren - seien die folgenden Insekten genannt:

Käfer wie

15 *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpinii*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*.

20

Hautflügler wie

Sirex juvencus, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

Termiten wie

25 *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*.

Borstenschwänze wie *Lepisma saccharina*.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

- 5 Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.

10 Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft zu verstehen:

Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Teleformasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

15

Die Wirkstoffe können als solche, in Form von Konzentraten oder allgemein üblichen Formulierungen wie Pulver, Granulate, Lösungen, Suspensionen, Emulsionen oder Pasten angewendet werden.

20

Die genannten Formulierungen können in an sich bekannter Weise hergestellt werden, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit mindestens einem Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgator, Dispergier- und/oder Binde- oder Fixiermittels, Wasser-Repellent, gegebenenfalls Sikkative und UV-Stabilisatoren und gegebenenfalls Farbstoffen und Pigmenten sowie weiteren Verarbeitungshilfsmitteln.

25

Die zum Schutz von Holz und Holzwerkstoffen verwendeten insektiziden Mittel oder Konzentrate enthalten den erfindungsgemäßen Wirkstoff in einer Konzentration von 0,0001 bis 95 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 60 Gew.-%.

30

Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge

kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

- 5 Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder öartiges schwer flüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

10

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder öartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und öartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle oder deren Aromatenfraktionen oder mineralöhlhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

15

- 20 Vorteilhaft gelangen Mineralöle mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Testbenzin mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Spindelöl mit einem Siedebereich von 250 bis 350°C, Petroleum bzw. Aromaten vom Siedebereich von 160 bis 280°C, Terpentinöl und dergleichen zum Einsatz.

20

- 25 In einer bevorzugten Ausführungsform werden flüssige aliphatische Kohlenwasserstoffe mit einem Siedebereich von 180 bis 210°C oder hochsiedende Gemische von aromatischen und aliphatischen Kohlenwasserstoffen mit einem Siedebereich von 180 bis 220°C und/oder Spindelöl und/oder Monochlornaphthalin, vorzugsweise α -Monochlornaphthalin, verwendet.

25

- 30 Die organischen schwerflüchtigen öligen oder öartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-

30

chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, dass das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und dass das Insektizid-Fungizid-Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

5

Nach einer bevorzugten Ausführungsform wird ein Teil des organisch-chemischen Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisches durch ein aliphatisches polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch ersetzt. Vorzugsweise gelangen Hydroxyl- und/oder Ester- und/oder Ethergruppen enthaltende aliphatische organisch-chemische Lösungsmittel wie beispielsweise Glycoether, Ester oder dergleichen zur Anwendung.

10

Als organisch-chemische Bindemittel werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung die an sich bekannten wasserverdünnbaren und/oder in den eingesetzten organisch-chemischen Lösungsmitteln löslichen oder dispergier- bzw. emulgierbaren Kunstharze und/oder bindende trocknende Öle, insbesondere Bindemittel bestehend aus oder enthaltend ein Acrylatharz, ein Vinylharz, z.B. Polyvinylacetat, Polyesterharz, Polykondensations- oder Polyadditionsharz, Polyurethanharz, Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz, Phenolharz, Kohlenwasserstoffharz wie Inden-

15

20

Cumaronharz, Siliconharz, trocknende pflanzliche und/oder trocknende Öle und/oder physikalisch trocknende Bindemittel auf der Basis eines Natur- und/oder Kunstharzes verwendet.

Das als Bindemittel verwendete Kunstharz kann in Form einer Emulsion, Dispersion oder Lösung, eingesetzt werden. Als Bindemittel können auch Bitumen oder bituminöse Substanzen bis zu 10 Gew.-%, verwendet werden. Zusätzlich können an sich bekannte Farbstoffe, Pigmente, wasserabweisende Mittel, Geruchskorrigentien und Inhibitoren bzw. Korrosionsschutzmittel und dergleichen eingesetzt werden.

25

30

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches

Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

- 5 Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungsmittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Ausfällen vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).

10

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Gly-

15

koether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

Fixierungsmittel basieren chemisch auf Polyvinylalkylethern wie z.B. Polyvinylmethylether oder Ketonen wie Benzophenon, Ethylenbenzophenon.

20

Als Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel kommt insbesondere auch Wasser in Frage, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der oben genannten organisch-chemischen Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgatoren und Dispergatoren.

25

Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.

Die anwendungsfertigen Mittel können gegebenenfalls noch weitere Insektizide und gegebenenfalls noch ein oder mehrere Fungizide enthalten.

Als zusätzliche Zumischpartner kommen vorzugsweise die in der WO 94/29 268 genannten Insektizide und Fungizide in Frage. Die in diesem Dokument genannten Verbindungen sind ausdrücklicher Bestandteil der vorliegenden Anmeldung.

- 5 Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyrifos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyfenozide und Triflumuron,
sowie Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole,
10 Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluamid, Tolyfluanid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamate, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.

- 15 Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken, Kaianlagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

- 20 Bewuchs durch sessile Oligochaeten, wie Kalkröhrenwürmer sowie durch Muscheln und Arten der Gruppe Lédamorpha (Entenmuscheln), wie verschiedene Lepas- und Scalpellum-Arten, oder durch Arten der Gruppe Balanomorpha (Seepocken), wie Balamus- oder Pollicipes-Species, erhöht den Reibungswiderstand von Schiffen und führt in der Folge durch erhöhten Energieverbrauch und darüber hinaus durch häufige Trockendockaufenthalte zu einer deutlichen Steigerung der Betriebskosten.

- 25 Neben dem Bewuchs durch Algen, beispielsweise Ectocarpus sp. und Ceramium sp., kommt insbesondere dem Bewuchs durch sessile Entomostraken-Gruppen, welche unter dem Namen Cirripedia (Rankenflussskrebse) zusammengefasst werden, besondere Bedeutung zu.

30

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, eine hervorragende Antifouling (Antibewuchs)-Wirkung aufweisen.

- 5 Durch Einsatz von erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, kann auf den Einsatz von Schwermetallen wie z.B. in Bis-(trialkylzinn)-sulfiden, Tri-*n*-butylzinnlaurat, Tri-*n*-butylzinncchlorid, Kupfer(I)-oxid, Triethylzinncchlorid, Tri-*n*-butyl(2-phenyl-4-chlorphenoxy)-zinn, Tributylzinnoxid, Molybdändisulfid, Antimonoxid, polymerem Butyltitanat, Phenyl-(bispyridin)-wismutchlorid, Tri-*n*-butylzinncfluorid, Manganethylenbisthiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisthiocarbamat, Zink- und Kupfersalze von 2-Pyridin-thiol-1-oxid, Bisdimethyldithiocarbamoylzinkethylenbisthiocarbamat, Zinkoxid, Kupfer(I)-ethylen-bisdithiocarbamat, Kupferthiocyanat, Kupfernaphthenat und Tri-butylzinnchalogeniden verzichtet werden oder die Konzentration dieser Verbindungen
- 10
- 15 entscheidend reduziert werden.

Die anwendungsfertigen Antifoulingfarben können gegebenenfalls noch andere Wirkstoffe, vorzugsweise Algizide, Fungizide, Herbizide, Molluskizide bzw. andere Antifouling-Wirkstoffe enthalten.

20

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel eignen sich vorzugsweise:

Algizide wie

- 25 2-*tert*.-Butylamino-4-cyclopropylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine und Terbutryn;

Fungizide wie

- 30 Benzo[*b*]thiophencarbonsäurecyclohexylamid-S,S-dioxid, Dichlofluamid, Fluorfolpet, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, Tolyfluamid und Azole wie

Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole;

Molluskizide wie

- 5 Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb;
oder herkömmliche Antifouling-Wirkstoffe wie
4,5-Dichlor-2-octyl-4-isothiazolin-3-on, Diiodmethylparatrylsulfon, 2-(N,N-Di-
methylthiocarbamoylthio)-5-nitrothiazyl, Kalium-, Kupfer-, Natrium- und Zinksalze
von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Pyridin-triphenylboran, Tetrabutyl-distannoxan, 2,3,5,6-
10 Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin, 2,4,5,6-Tetrachloroisophthalonitril, Tetrame-
thylthiuramdisulfid und 2,4,6-Trichlorphenylmaleinimid.

- Die verwendeten Antifouling-Mittel enthalten die erfindungsgemäßen Wirkstoff der
erfindungsgemäßen Verbindungen in einer Konzentration von 0,001 bis 50 Gew.-%,
15 insbesondere von 0,01 bis 20 Gew.-%.

- Die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel enthalten desweiteren die üblichen
Bestandteile wie z.B. in Ungerer, *Chem. Ind.* 1985, 37, 730-732 und Williams,
Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973 beschrieben.

- 20 Antifouling-Anstrichmittel enthalten neben den algiziden, fungiziden, molluskiziden
und erfindungsgemäßen insektiziden Wirkstoffen insbesondere Bindemittel.

- Beispiele für anerkannte Bindemittel sind Polyvinylchlorid in einem Lösungsmittel-
25 system, chlorierter Kautschuk in einem Lösungsmittelsystem, Acrylharze in einem
Lösungsmittelsystem insbesondere in einem wässrigen System, Vinylchlorid/Vinyl-
acetat-Copolymersysteme in Form wässriger Dispersionen oder in Form von
organischen Lösungsmittelsystemen, Butadien/Styrol/Acrylnitril-Kautschuke, trock-
nende Öle, wie Leinsamenöl, Harzester oder modifizierte Hartharze in Kombination
30 mit Teer oder Bitumina, Asphalt sowie Epoxyverbindungen, geringe Mengen Chlor-
kautschuk, chloriertes Polypropylen und Vinylharze.

Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling-Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten Mischungen eingearbeitet werden.

10

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

Aus der Ordnung der Scorpionidea z.B. *Buthus occitanus*.

20 Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* sp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

Aus der Ordnung der Araneae z.B. *Aviculariidae*, *Araneidae*.

25 Aus der Ordnung der Opiliones z.B. *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp..

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus* spp..

30 Aus der Ordnung der Zygentoma z.B. *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

- Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.
- 5 Aus der Ordnung der Saltatoria z.B. *Acheta domesticus*.
 Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.
 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Kaloterme* spp., *Reticulitermes* spp.
 Aus der Ordnung der Psocoptera z.B. *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.
- 10 Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp.,
Latheticus oryzae, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
 Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma pluvialis*,
Culex quinquefasciatus, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia*
- 15 *canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.
 Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.
 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- 20 Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.
 Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.
- 25 Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.
- 30 Die Anwendung im Bereich der Haushaltinsektizide erfolgt allein oder in Kombination mit anderen geeigneten Wirkstoffen wie Phosphorsäureestern,

Carbamaten, Pyrethroiden, Wachstumsregulatoren oder Wirkstoffen aus anderen bekannten Insektizidklassen.

5 Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gel- und Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckchen und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködem oder Köderstationen.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defolianta, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder

15 selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

20 Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Elix, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver,

25 Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita,

30 Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Monokotyle Unkräuter 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, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

15

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuss-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

20

Die erfindungsgemäßen Verbindungen zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

25

30

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und pilzlichen oder bakteriellen Pflanzenkrankheiten verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse

Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum-
5 erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und
10 Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospho-
15 lipide, wie Kepheline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-
20 farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden und/oder mit Stoffen, welche die Kulturpflanzen-Verträglichkeit verbessern („Safenem“) zur Unkrautbekämpfung verwendet werden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind. Es
30 sind also auch Mischungen mit Unkrautbekämpfungsmitteln möglich, welche ein oder mehrere bekannte Herbizide und einen Safener enthalten.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

- 5 Acetochlor, Acifluorfen (-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim (-sodium),
Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine,
Azafenidin, Azimsulfuron, BAS-662H, Beflubutamid, Benazolin (-ethyl), Ben-
furesate, Bensulfuron (-methyl), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzo-
fenap, Benzoylprop (-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodium), Bromo-
butide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil (-allyl), Butroxydim,
10 Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone (-ethyl), Chlo-
methoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron (-ethyl), Chlornitrofen, Chlor-
sulfuron, Chlortoluron, Cinidon (-ethyl), Cinnethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim,
Clethodim, Clodinafop (-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyra-
sulfuron (-methyl), Cloransulam (-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne,
15 Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop (-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, Des-
medipham, Diallylate, Dicamba, Dichlorprop (-P), Diclofop (-methyl), Diclosulam, Di-
ethatyl (-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate,
Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphen-
amid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethal-
fluralin, Ethametsulfuron (-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Eto-
benzamid, Fenoxaprop (-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop (-isopropyl, -isopropyl-L,
-methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop (-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone
(-sodium), Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac (-pentyl), Flumioxazin, Flumi-
propyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-ethyl), Flu-
25 poxam, Flupropacil, Flurpysulfuron (-methyl, -sodium), Flurenol (-butyl),
Fluridone, Fluroxypyr (-butoxypropyl, -methyl), Flurprimidol, Flurtamone, Flu-
thiacet (-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate (-ammo-
nium), Glyphosate (-isopropylammonium), Halosafen, Haloxypyr (-ethoxyethyl, -P-
methyl), Hexazinone, Imazamethabenz (-methyl), Imazamethapyr, Imazamox,
30 Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron (-methyl,
-sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxa-

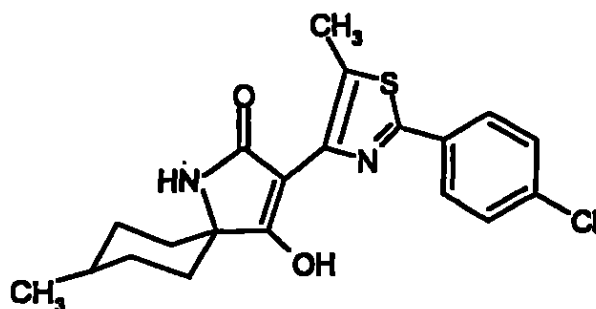
flutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, Mecoprop, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-) Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron (-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron (-methyl), Profluazol, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propoxycarbazone (-sodium), Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-ethyl), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid, Pyriminobac (-methyl), Pyriothiobac (-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop (-P-ethyl, -P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron (-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron (-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron (-methyl), Tritosulfuron.

20 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

25 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

- 5 Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.
- 10 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele**Beispiel I-1-A-a-1**

5

3,70 g (0,031 Mol) Kalium-tert.-butylat werden in 26 ml wasserfreiem DMF bei 0°C vorgelegt und 6 g der Verbindung gemäß Beispiel II-1 in 12 ml wasserfreiem DMF zugegeben. Man rührt 1 h bei 20°C.

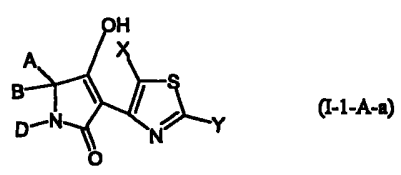
- 10 Die Reaktionslösung gibt man in 200 ml Eiswasser und säuert bei 0-10°C an. Anschließend saugt man den Niederschlag ab und kristallisiert um.

Ausbeute: 4,66 g ($\pm$ 83 % der Theorie), Fp. > 260°C.

- 15 DMF (Dimethylformamid)

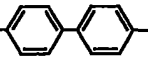


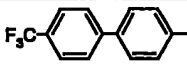
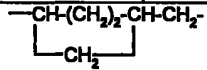
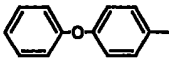
In Analogie zu Beispiel (I-1-A-a-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (I-1-A-a)



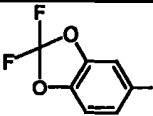
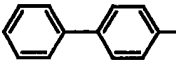
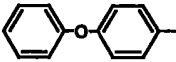
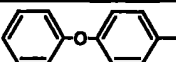
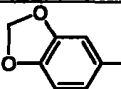
Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isomer
I-1-A-a-2	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	230	-
I-1-A-a-3	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		246	β
I-1-A-a-4	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		>250	β
I-1-A-a-5	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ O-(CH ₂) ₂ -		>265	-
I-1-A-a-6	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>250	-
I-1-A-a-7	-C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		250	β
I-1-A-a-8	-CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		244	β
I-1-A-a-9	-CH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		406	β
I-1-A-a-10	-C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	176	-
I-1-A-a-11	-CH ₃	C ₆ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		235	β
I-1-A-a-12	-CH ₃	2-Cl, 6-OCH ₃ -C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		249	β

22

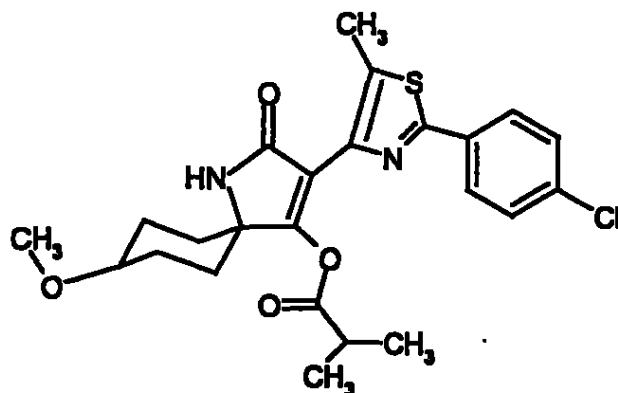
Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isomer
I-1-A-a-13	-CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	228	-
I-1-A-a-14	-CH ₃	C ₆ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	177	-
I-1-A-a-15	-C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		204	β
I-1-A-a-16	-CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		235	β
I-1-A-a-17	-CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		235	β
I-1-A-a-18	-CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		258	β
I-1-A-a-19	-CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	172	-
I-1-A-a-20	-CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	CH ₃	CH ₃	211	-
I-1-A-a-21	-CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	220	-
I-1-A-a-22	-CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	218	-
I-1-A-a-23	-C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃		-
I-1-A-a-24	Br	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			β
I-1-A-a-25	CH ₃	F ₃ C- 	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			β
I-1-A-a-26	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			β
I-1-A-a-27	Br	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	143	-
I-1-A-a-28	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	208	-

Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isomer
I-1-A-a-29	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	226	-
I-1-A-a-30	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -	H				β
I-1-A-a-31	C ₂ H ₇	4-Cl- C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	162	-
I-1-A-a-32	CH ₃	2-Cl- C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		261	α
I-1-A-a-33	CH ₃	3-Cl- C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		245	β
I-1-A-a-34	CH ₃	3-Cl- C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	212	-
I-1-A-a-35	CH ₃	4-Cl- C ₆ H ₄ -CH ₂ -	H	CH ₃	CH ₃	139	-
I-1-A-a-36	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		220	α
I-1-A-a-37	CH ₃	4-Cl- C ₆ H ₄ -CH ₂ -	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		205	β
I-1-A-a-38	i-C ₃ H ₇	4-Cl- C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		274	β
I-1-A-a-39	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	181	-

172

Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isomer
I-1-A-a-40	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	205	-
I-1-A-a-41	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	254	-
I-1-A-a-42	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		225	β
I-1-A-a-43	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ C- C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		252	β
I-1-A-a-44	CH ₃	4-Cl- C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -		291	-
I-1-A-a-45	CH ₃	4-Cl- C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₂		H	197	-
I-1-A-a-46	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		252	α
I-1-A-a-47	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	121	-
I-1-A-a-48	CH ₃	4-Cl- C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₄ -		H		

- 123 -

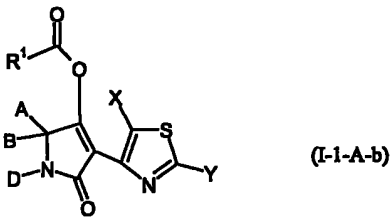
Beispiel I-1-A-b-1

0,81 g der Verbindung gemäß Beispiel I-1-a-2 werden in 10 ml wasserfreiem Essigsäureethylester vorgelegt und mit 0,3 ml (2,2 mmol) Triethylamin unter Rückfluss erhitzt. Anschließend gibt man 0,25 ml (0,0022 Mol) Isobuttersäurechlorid in 5 ml
5 wasserfreiem Essigsäureethylester hinzu und erhitzt unter Rückfluss.

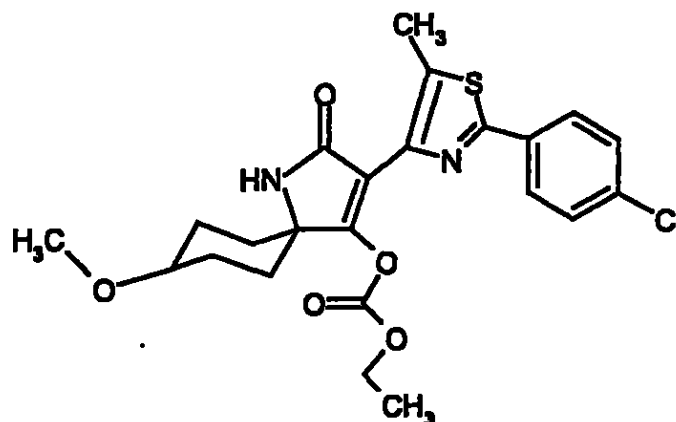
Nach beendeter Reaktion (DC-Kontrolle) wird das Lösungsmittel abdestilliert und der Rückstand in Dichlormethan aufgenommen, zweimal mit 10 ml 0,5 N NaOH
10 gewaschen, getrocknet und einrotiert. Der Rückstand wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt (Dichlormethan/Essigsäureethylester, 3:1).

Ausbeute: 0,2 g ($\approx$ 21 % d.Th.), Fp 208°C.

In Analogie zu Beispiel (I-1-A-b-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (I-1-A-b)



Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	R ¹	Fp°C	Isomer
I-1-A-b-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			273	-
I-1-A-b-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			249	B

Beispiel I-1-A-c-1

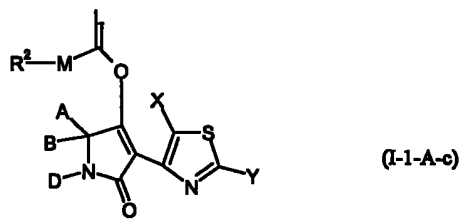
0,69 g der Verbindung gemäß Beispiel I-1-a-2 werden in 10 ml wasserfreiem
Dichlormethan vorgelegt und bei 10°C mit 0,24 ml (1,7 mmol) Triethylamin ver-
setzt.

Anschließend gibt man 0,17 ml (1,7 mmol) Chlorameisensäure-ethylester in 1 ml
wasserfreiem Dichlormethan hinzu und rührt bei Raumtemperatur.

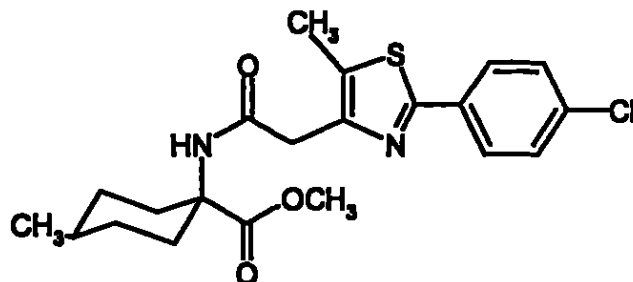
10 Nach beendeter Reaktion (DC-Kontrolle) wird das Lösungsmittel abdestilliert und
der Rückstand in Dichlormethan aufgenommen, zweimal mit 10 ml 0,5 N NaOH
gewaschen, getrocknet und einrotiert. Der Rückstand wird säulenchromatographisch
an Kieselgel gereinigt (Dichlormethan/Essigsäureethylester, 3:1).

15 Ausbeute: 0,58 g ($\pm$ 71 % d.Th), Fp. 211°C.

In Analogie zu Beispiel (I-1-A-c-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (I-1-A-c)



Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	L	M	R ²	Fp°C	Isomer
I-1-A-c-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O		-	β
I-1-A-c-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O		292	β
I-1-A-c-4	CH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O	C ₂ H ₅	-	β

Beispiel II-A-1

5 Zu 4,61 g 4-Methyl-1-amino-cyclohexan-1-carbonsäuremethylester-hydrochlorid in 80 ml wasserfreiem Tetrahydrofuran gibt man 6,6 ml Triethylamin und rührt 3 Min. 5,3 g 4-[2-(4-Chlorphenyl)-5-methyl]-thiazolyl-essigsäure werden zugegeben. Man rührt weitere 15 Min. bei Raumtemperatur. Anschließend gibt man 4,4 ml Triethylamin zu und tropft sofort 1,12 ml Phosphoroxychlorid zu, dass die Lösung mässig siedet. Man erhitzt 30 Min. unter Rückfluss.

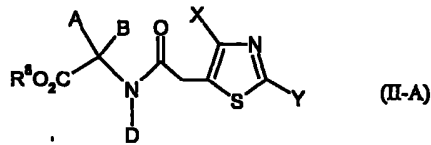
10

Die Reaktionslösung wird in 200 ml Eiswasser gegeben, mit Dichlormethan extrahiert und getrocknet. Das Lösungsmittel wird abdestilliert und der Rückstand umkristallisiert.

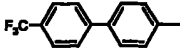
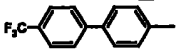
15

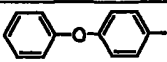
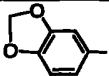
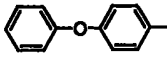
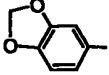
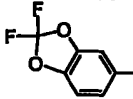
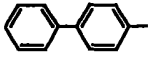
Ansbeute: 6,19 g ($\approx$ 73 % d. Th.), Fp: 150°C.

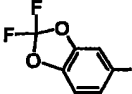
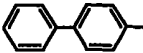
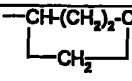
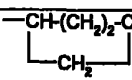
In Analogie zu den Beispielen (II-A-1) und (II-A-48) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (II-A)

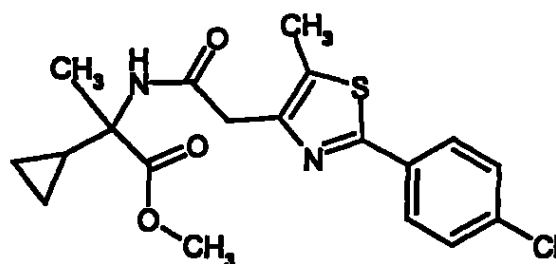


Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	R ⁸	Fp°C	Isomer
II-A-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	121	B
II-A-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	120	B
II-A-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	201	-
II-A-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	132	-
II-A-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	139	-
II-A-7	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	124	B
II-A-8	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	106	-
II-A-9	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	164	-
II-A-10	CH ₃	C ₆ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	142	-
II-A-11	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	119	B
II-A-12	CH ₃	C ₆ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	143	B
II-A-13	CH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	Öl	B
II-A-14	CH ₃	2-Cl, 6-F-C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	Öl	B

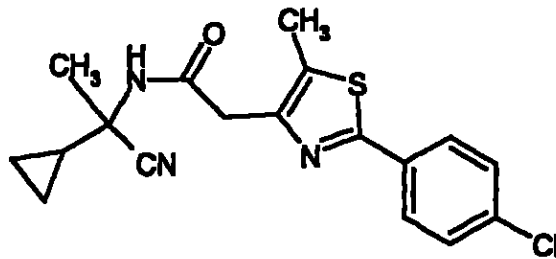
Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	R ⁸	Fp°C	Isomer
II-A-15	C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	114	β
II-A-16	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	128	β
II-A-17	C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	129	-
II-A-18	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	112	-
II-A-19	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	136	-
II-A-20	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	119	-
II-A-21	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	124	β
II-A-22	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	110	β
II-A-23	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	130	β
II-A-24	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	135	-
II-A-25	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	160	-
II-A-26	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	129	β
II-A-27	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	168	β
II-A-28	Br	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	127	-
II-A-29	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	163	-
II-A-30	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	160	-
II-A-31	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	144	-

Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	R ⁸	Fp°C	Isomer
II-A-32	$i\text{-C}_3\text{H}_7$	4-Cl-C ₆ H ₄	H	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$		CH ₃	123	β
II-A-33	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂	H	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$		CH ₃	108	β
II-A-34	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	109	-
II-A-35	CH ₃		H	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$		CH ₃	108	β
II-A-36	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	132	-
II-A-37	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Oil	-
II-A-38	CH ₃		H	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$		CH ₃	118	β
II-A-39	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	$-(\text{CH}_2)_2\text{-C(CH}_3)_2\text{-(CH}_2)_2\text{-}$		CH ₃	177	-
II-A-40	CH ₃		H	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$		CH ₃	157	β
II-A-41	CH ₃		H	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$		CH ₃	137	β
II-A-42	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄	H	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$		CH ₃	115	β

Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	R ⁸	Fp°C	Isomer
II-A-43	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	125	-
II-A-44	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	146	-
II-A-45	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₄ -	H	C ₂ H ₅	Öl	-	-
II-A-46	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₂ -	H	C ₂ H ₅	Öl	-	-
II-A-47	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	1-C ₃ H ₇	H	H	C ₂ H ₅	Öl	-
II-A-48	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H		CH ₃	CH ₃		
II-A-49	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	1-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃		
II-A-50	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H		CH ₃			ß
II-A-51	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H		CH ₃			α
II-A-52	Br	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	127		ß
II-A-53	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃			ß
II-A-54	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	136		ß

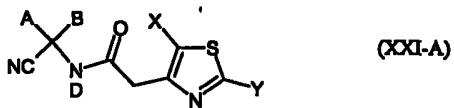
Beispiel-Nr. II-A-48

- 7,4 g (0,075 mol) konzentrierte Schwefelsäure werden vorgelegt und 5,37 g der Verbindung gemäß Herstellungsbeispiel XXI-A-1 in 30 ml Methylenchlorid bei einer Innentemperatur von 30 bis 40°C zugetropft. Anschließend wird 2 Stunden bei 30 bis 40°C nachgeführt. Man tropft 11 ml absolutes Methanol zu, dass sich eine Innentemperatur von 40°C einstellt. Es wird 6 Stunden bei 40 bis 70°C weitergeführt.
- 10 Die Reaktionslösung wird auf 0,08 kg Eis gegeben. Man extrahiert mit Dichlormethan, wäscht mit NaHCO₃-Lösung, trocknet und destilliert das Lösungsmittel ab. Anschließend wird der Rückstand säulenchromatographisch über Kieselgel (Dichlormethan/Essigsäureethylester, 5:1) gereinigt.
- 15 Man erhält 0,42 g ($\pm$ 7 % der Theorie), Fp. 131°C.

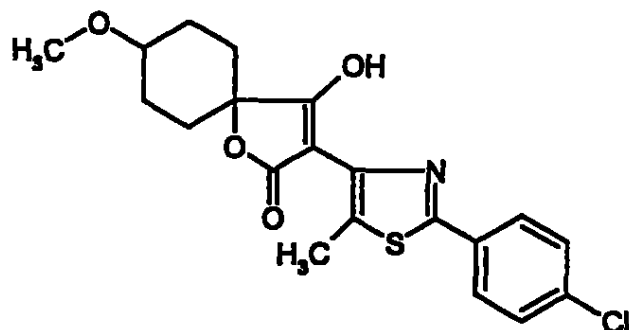
Beispiel XXI-A-1

- 5 3,7 g 2-Amino-2-cyclopropyl-propionitril in 60 ml absolutem Tetrahydrofuran und 4,92 ml Triethylamin werden 5 min gerührt. Dann gibt man 8,03 g 5-Methyl-2-(4-chlor-phenyl)-thiazolyleessigsäure zu und rührt 15 min bei Raumtemperatur. Es werden 6,6 ml Triethylamin zugegeben und sofort 1,68 ml Phosphoroxychlorid so zugetropft, dass die Lösung mäßig siedet.
- 10 Man rührt 30 min unter Rückfluss. Das Lösungsmittel wird anschließend abdestilliert und der Rückstand säulenchromatographisch an Kieselgel (n-Hexan/Essigsäureethylester, 2:1) gereinigt.
- 15 Ausbeute: 5,37 g (49 % d. Th.), Fp. 114°C.

In Analogie zu Beispiel (XXI-A-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (XXI-A)

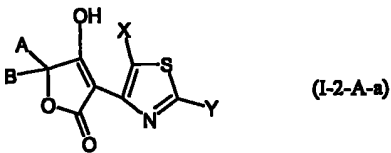


Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	Fp°C
XXI-1-A -2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -		147
XXI-1-A -3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	134
XXI-1-A -4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-CH-(CH ₂) ₂ -CH-CH ₂ - CH ₂		151

Beispiel I-2-A-a-1

- 5 Zu 2,48 g (5,49 mmol) der Verbindung gemäß Beispiel III-1 in 10 ml wasserfreiem DMF gibt man unter Eiskühlung 6,6 ml 1 M Kalium-tert.-butylat-Lösung und rührt bei Raumtemperatur über Nacht. Das Lösungsmittel wird abdestilliert, der Rückstand in Wasser gelöst, langsam mit konz. HCl angesäuert, abgesaugt und getrocknet. Ausbeute: 2 g (Δ 89 % d.Th.), Fp. 117-120°C.

In Analogie zu Beispiel (I-2-A-a-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (I-2-A-a)

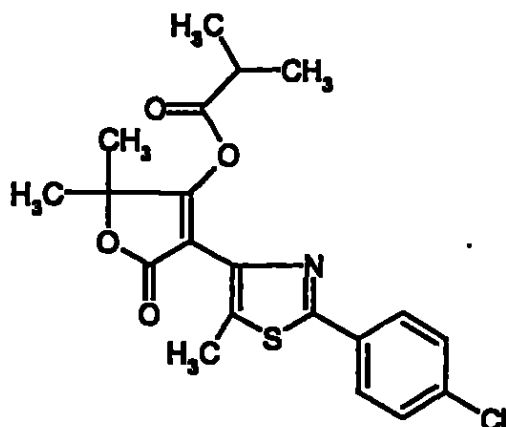


Bsp -Nr	X	Y	A	B	Fp°C
I-2-A-a-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	133-135
I-2-A-a-3	CH ₃	C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		
I-2-A-a-4	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	

¹H-NMR (CDCl₃)

Bsp -Nr I-2-A-a-3 δ = 1 45-2 25 (m, 8H), 2 90/3 00 (2s, 3H), 3 30/3 40 (2s, 3H), 3 25/3 50 (2m, 1H), 7 35-8 25 (m, 5H)

5 Bsp -Nr I-2-A-a-4 δ = 1 60 (s, 6H), 2 95 (s, 3H), 7 45 (m, 3H), 7 80 (m, 2H)

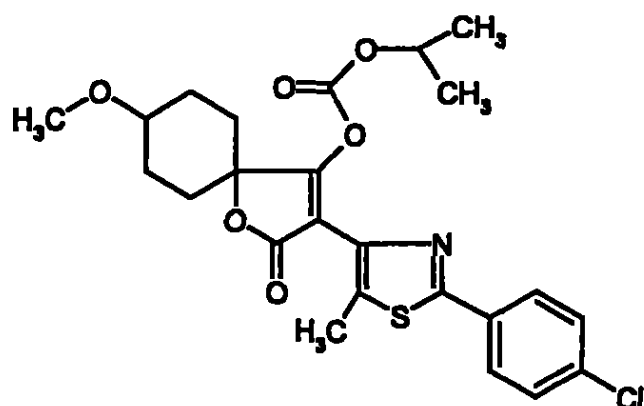
Beispiel I-2-A-b-1

5 Zu 0,7 g (2,1 mmol) der Verbindung gemäß Herstellungsbeispiel III-A-2 in absolutem Dichlormethan und 0,232 g (2,3 mmol) Triethylamin gibt man bei 0 bis 10°C 0,244 g (2,3 mmol) Isobuttersäurechlorid und rührt bei Raumtemperatur 8 Stunden. Die Reaktionslösung wird mit 10 % Zitronensäure und 10 % NaOH-Lösung gewaschen. Die organische Phase wird abgetrennt, getrocknet und eingengt.

10

Es wird säulenchromatographisch gereinigt über Kieselgel (Dichlormethan/Essigsäureethylester, 20/1).

Ausbeute: 0,1 g $\triangleq$ 11,8 % der Theorie, Fp. 95-98°C.

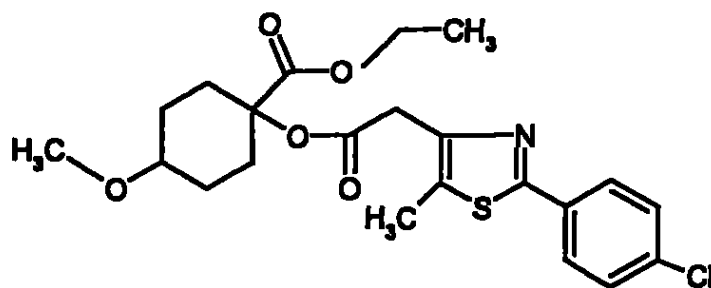
Beispiel I-2-A-c-1

- 5 Zu 0,75 g (1,85 mmol) gemäß Beispiel I-2-A-1 in absolutem Dichlormethan und 0,206 g (2 mmol) Triethylamin gibt man bei 0 bis 10°C Chlorameisensäureisopropylester (0,249 g, 2 mmol, 1 M in Toluol). Man rührt 8 Stunden bei Raumtemperatur. Man wäscht mit 10 % Zitronensäurelösung und mit 10 %iger NaOH-Lösung, trennt die organische Phase ab, trocknet und destilliert das Lösungsmittel ab.

10

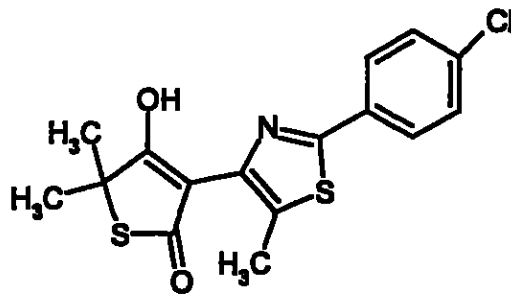
Es wird säulenchromatographisch gereinigt über Kieselgel (Dichlormethan/Essigsäureethylester, 20/1).

Ausbeute: 0,37 g $\pm$ 40 % der Theorie, Fp. 140-145°C.

Beispiel III-A-1

- 5 1,11 g (5,49 mmol) 4-Methoxy-1-hydroxy-cyclohexan-1-carbonsäureethylester und 1,57 g (5,49 mmol) der Verbindung gemäß Beispiel XVI-1 werden 6 h bei 140°C verrührt, abgekühlt und das HCl-Gas mit Argon angeblasen.

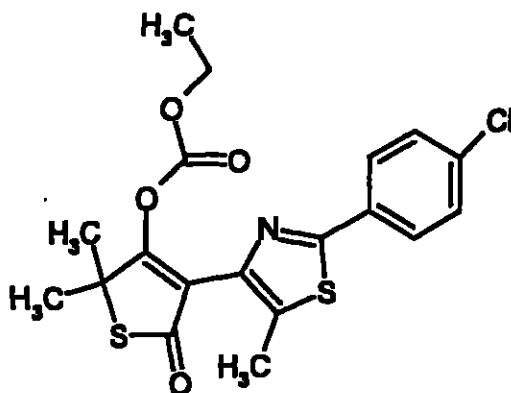
Ausbeute: 2,4 g ($\cong$ 41,62 % d.Th.), LogP (sauer) 4,54 (HPLC; Acetonitril).

Beispiel I-3-A-a-1

- 5 15 g (20 mmol) der Verbindung gemäß Beispiel (IV-A-1) wird in 22 ml Trifluor-
essigsäure (TFA) und 51 ml Toluol vorgelegt und über Nacht unter Rückfluss erhitzt.
Das Lösungsmittel und die TFA werden abdestilliert, der Rückstand in 200 ml Was-
ser und 200 ml Methyl-tert.-butylether aufgenommen. Die organische Phase wird
10 alkalisch extrahiert und die wässrige Phase angesäuert, mit Dichlormethan extrahiert,
getrocknet und das Lösungsmittel abdestilliert.

Es wird säulenchromatographisch über Kieselgel (Dichlormethan/Essigsäureethyl-
ester, 10:1 → 5:1) gereinigt.

- 15 Ausbeute: 1,6 g (23 % d. Th.), Fp. 132-135°C.

Beispiel I-3-A-c-1

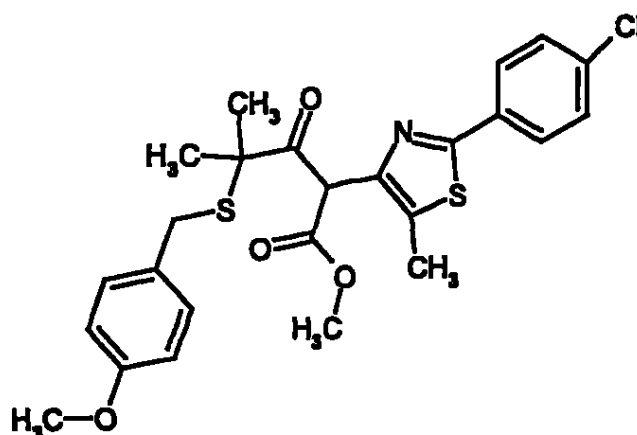
- 5 500 mg (1,4 mmol) der Verbindung gemäß Beispiel (I-3-A-a-1) werden in 5 ml absolutem Dichlormethan vorgelegt, mit 0,29 ml (2,1 mmol, 1,5 eq) Triethylamin versetzt und unter Eiskühlung 0,2 g (1,8 mmol, 1,3 eq) Chlorameisensäureethylester zugegeben.
- 10 Es wird 2 Stunden bei Raumtemperatur geführt. Man wäscht mit 10 %iger Citronensäure, extrahiert mit Dichlormethan, wäscht mit 1 N NaOH, extrahiert mit Dichlormethan, trocknet und destilliert das Lösungsmittel ab.

Ausbeute: 0,55 g (93 % d. Th.), Öl

15

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400 MHz): δ = 0,93 (t, 3H, $\text{CH}_3\text{-CH}_2$), 1,75 (s, 6H, 2 $\text{CH}_3\text{-C}$), 2,37 (s, 3H, $\text{CH}_3\text{-C arom.}$), 3,98 (q, 2H, $\text{CH}_3\text{-CH}_2$), 7,55 (d, 2H, 2 CH arom.), 7,87 (d, 2H, 2 CH arom.) ppm.

- 143 -

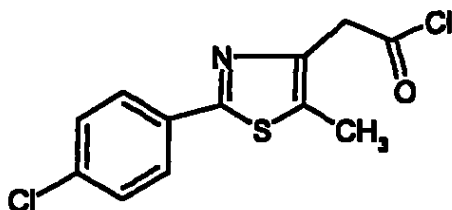
Beispiel IV-A-1

Es wird 4,8 g (20,0 mmol) 2-(4-Methoxy-benzylthio)-2-methyl-propionsäure in 40 ml wasserfreiem Toluol und 1 Tropfen DMF vorgelegt und 7,2 g (60 mmol, 4 ml)
 5 Thionylchlorid zugesetzt. Man rührt 5 min bei Raumtemperatur, anschließend bei 100°C, bis die Gasentwicklung beendet ist. Das Lösungsmittel wird abdestilliert und der Rückstand in 10 ml wasserfreiem Tetrahydrofuran aufgenommen (Lösung A).

17,1 ml Lithium-diisopropylamid in 40 ml wasserfreiem Tetrahydrofuran werden bei
 10 0°C vorgelegt und 10,1 g (32,7 mmol) 4-[5-Methyl-2-(4-chlor-phenyl)]-thiazolyl-essigsäuremethylester in 10 ml wasserfreiem Tetrahydrofuran bei 0°C zugetropft und 30 min nachgerührt. Anschließend tropft man Lösung A bei 0°C zu und rührt 1 h bei Raumtemperatur nach. Anschließend versetzt man die Reaktionsmischung mit 100 ml MTB-Ether und einigen Tropfen Wasser und wäscht 2 x mit je 100 ml
 15 10 %iger NH₄Cl-Lösung, die organische Phase wird getrocknet und das Lösungsmittel abdestilliert. Das Rohprodukt wird ohne weitere Reinigung umgesetzt.

Ausbeute: 15,2 g (100 % d. Th.).

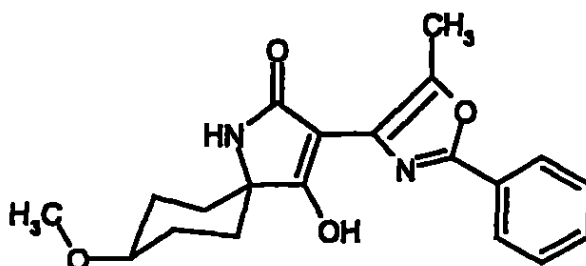
20 ¹H-NMR (DMSO, 400 MHz): δ = 1,43 (s, 3H, CH₃-C aliph.), 1,50 (s, 3H, CH₃-C aliph.), 2,40 (s, 3H, CH₃-C heteroarom.), 3,31 (s, 2H, CH₂), 3,61 (s, 3H, CH₃-OCO), 3,82 (s, 3H, CH₃-O) ppm.

Beispiel XVI-1

- 5 3 g (11,21 mmol) 4-[2-(4-Chlorphenyl)-5-methyl]-thiazolyl-essigsäure werden in 50 ml absolutem Dichlormethan vorgelegt. Unter Eiskühlung werden 2,13 g (16,81 mmol) Oxalsäurechlorid langsam zutropft, über Nacht bei Raumtemperatur gerührt und anschließend 2 h unter Rückfluss erhitzt und das Lösungsmittel abdestil-

10

Ausbeute: 3,19 g (96 % d.Th.).

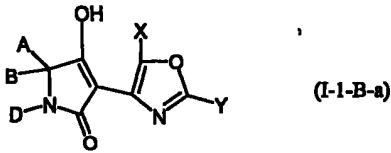
Beispiel I-1-B-a-1

- 5 Zu 2,41 g (0,020 mol) Kalium-tert.-butylat in 17 ml wasserfreiem Dimethylformamid (DMF) werden bei 20°C 3,59 g der Verbindung gemäß Herstellungsbeispiel II-B-1 in 7 ml wasserfreiem DMF zugetropft und bei 40°C 1 Stunde gerührt.

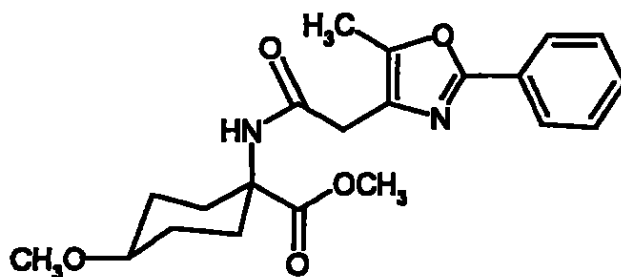
- 10 Die Reaktionslösung wird in 100 ml Eiswasser eingerührt und bei 0 bis 10°C mit Salzsäure angesäuert. Der Niederschlag wird abgesaugt und mit Methylencchlorid/Aceton 5:1 an Kieselgel chromatographiert.

Ausbeute: 1,2 g (36 % d. Th.), Fp >240°C

In Analogie zu Beispiel (I-1-B-a-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (I-1-B-a)



Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isomer
I-1-B-a-2	CH ₃	C ₆ H ₆	H	CH ₃	CH ₃	187	-
I-1-B-a-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		279	β

Beispiel II-B-1

- 5 4,56 g (20 mmol) 1-Amino-4-methoxy-cyclohexancarbonsäuremethylester-hydrochlorid werden in 60 ml absolutem THF vorgelegt, mit 6 ml Triethylamin versetzt und 5 min gerührt. Man gibt 3,27 g 4-(2-Phenyl-5-methyl)-oxazolyl-essigsäure zu und rührt bei Raumtemperatur 15 min. Es werden 3,3 ml Triethylamin zugegeben und 0,84 ml Phosphoroxychlorid so zugetropft, dass die Lösung mäßig siedet.

10

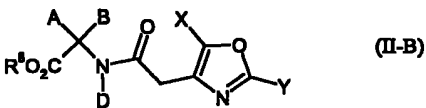
Man rührt 30 min unter Rückfluss.

Das Lösungsmittel wird abdestilliert und der Niederschlag säulenchromatographisch über Kieselgel (Dichlormethan/Essigsäureethylester, 3:1) gereinigt.

15

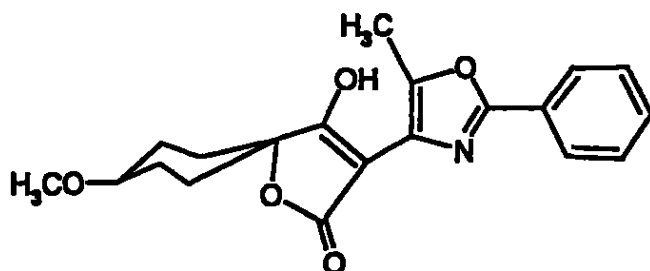
Ausbeute: 3,59 g (61 % d. Th.), Fp 125°C.

In Analogie zu Beispiel (II-B-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (II-B)



Bsp -Nr	X	Y	D	A	B	R ⁸	Fp°C	Isomer
II-B-2	CH ₃	C ₆ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	101	-
II-B-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	95	B

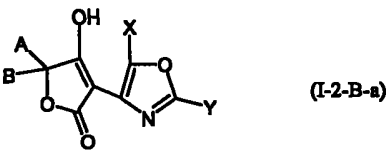
- 149 -

Beispiel I-2-B-a-1

- 5 1,01 g (5 mmol) 4-Methoxy-1-Hydroxy-cyclohexan-1-carbonsäureethylester und
1,095 g (5 mmol) 2-Phenyl-4-methyl-isoxazol-3-acetylchlorid wurden ohne Lösungsmittel über Nacht bei 140°C erwärmt und anschließend kurz im Vakuum entgast. Das erhaltene Rohprodukt wurde in 10 ml DMF gelöst. 6 ml 1M Lösung von KOtBu in DMF in 10 min zudosiert, über Nacht bei Raumtemperatur gerührt, zur Trockene einrotiert, der Rückstand in Wasser gelöst, 1 x mit Essigester extrahiert um Verunreinigungen zu entfernen, 10 ml 1N Salzsäure langsam zudosiert (bis sauer) und das ausgefallene Produkt abgesaugt. Die weitere Reinigung erfolgte durch präparative HPLC (Acetonitril/Wasser an RP-18):
- 10
- 15 Ausbeute: 0,33 g (19 % d. Th.), Fp. 65°C.

¹H-NMR MHz (CDCl₃) : δ = 1,60-2,30 (m, 8H), 2,85 (s, 3H), 3,30/3,40 (2s, 3H), 3,30/3,60 (2 m, 1H), 7,40-8,00 (m, 5H).

In Analogie zu Beispiel (I-2-B-a-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man folgende Verbindungen der Formel (I-2-B-a)



Bsp -Nr	X	Y	A	B	Pp°C
I-2-B-a-2	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	log P (pH2) 3,43

Anwendungsbeispiele:**Beispiel A****Meloidogyne-Test**

5

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid**Emulgator:** 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10

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

15

Gefäße werden mit Sand, Wirkstofflösung, Meloidogyne incognita-Bi-Larvensuspension und Salatsamen gefüllt. Die Salatsamen keimen und die Pflänzchen entwickeln sich. An den Wurzeln entwickeln sich die Gallen.

20

Nach der gewünschten Zeit wird die nematizide Wirkung an Hand der Gallenbildung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass keine Gallen gefunden wurden; 0% bedeutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der der unbehandelten Kontrolle entspricht.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit: I-2-a-1 und I-2-a-2.

Beispiel B**Myzus-Test**

- Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

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

15 Kohlblätter (*Brassica oleracea*), die stark von der Pfirsichblattlaus (*Myzus persicae*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

20 Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit: I-2-a-1, I-1-a-5, I-1-a-6 und I-1-a-8.

Beispiel C**Phaedon-Larven-Test**

- Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

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

Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven des Meerrettichkäfers (*Phaedon cochleariae*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.
15

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

- 20 Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit: I-2-a-1, I-2-a-2, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-2, I-1-a-1, I-1-c-1 und I-1-a-8.

Beispiel D**Spodoptera frugiperda-Test**

- Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

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

Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung
der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Heerwurms
(*Spodoptera frugiperda*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

15 Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%,
dass alle Raupen abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wur-
den.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele
20 gute Wirksamkeit: I-2-a-1, I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-2, I-1-a-1 und I-1-c-1.

Beispiel E**Tetranychus-Test (OP-resistent/Tauchbehandlung)**

- 5 Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

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

- 15 Bohnenpflanzen (*Phaseolus vulgaris*), die stark von allen Stadien der gemeinen
Spinnmilbe (*Tetranychus urticae*) befallen sind, werden in eine Wirkstoffzubereitung
der gewünschten Konzentration getaucht.

- Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%,
dass alle Spinnmilben abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Spinnmilben
abgetötet wurden.

- 20 Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele
gute Wirksamkeit: I-2-a-2, I-1-a-4, I-1-a-5 und I-1-a-6.

Beispiel F**Post-emergence-Test**

- Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton
5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkyarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 bis 15 cm haben so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

20 Es bedeuten:

- 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

Beispiel G**Pre-emergence-Test**

- Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton
5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkyaryl/polyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden mit der Wirkstoffzubereitung bespritzt so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

20 Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

- 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

pre-emergence	g ai/ha	Zucker-rüben	Raps	Alopecurus	Avena fatua	Lolium	Setaria	Matricaria
Bsp. I-2-a-1	125	0	0	90	100	100	100	100

post-emergence	g ai/ha	Raps	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Setaria	Amaranthus	Chenopodium
Bsp. I-2-a-1	250	20	80	95	100	100	70	70

pre-emergence	g ai/ha	Zucker-rüben	Raps	Avena fatua	Bromus	Lolium	Setaria
Bsp. I-2-a-2	250	0	0	90	90	100	100

post-emergence	g ai/ha	Zucker-rüben	Soja	Avena fatua	Digitaria	Echinochloa	Setaria
Bsp. I-2-a-2	250	0	0	90	90	100	95

5

post-emergence	g ai/ha	Alopecurus	Echinochloa	Amaranthus
Bsp. I-1-a-5	250	80	100	90

post-emergence	g ai/ha	Zucker-rüben	Alopecurus	Avena fatua	Digitaria	Echinochloa
Bsp. I-1-a-6	125	0	90	90	95	90

post-emergence	g ai/ha	Alopecurus	Echinochloa	Setaria	Amaranthus
Bsp. I-1-a-2	250	70	90	95	90

post-emergence	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Amaranthus	Sinapis
Bsp. I-1-a-1	250	80	80	95	70	80

post-emergence	g ai/ha	Reis	Avena fatua	Digitaria	Echinochloa	Stellaria
Bsp. I-1-a-3	250	10	100	100	100	90

post-emergence	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Setaria
Bsp. I-1-c-1	250	80	95	95	90

post-emergence	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Setaria	Abutilon	Amaranthus
Bsp. I-1-a-4	250	95	100	100	100	80	95
Bsp. I-1-b-1	250	95	100	100	100	80	80

Beispiel H**Grenzkonzentrations-Test / Bodeninsekten - Behandlung transgener Pflanzen**

5 Testinsekt: **Diabrotica balteata - Larven im Boden**

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Die Wirkstoffzubereitung wird auf den Boden gegossen. Dabei spielt die Konzentration des Wirkstoffs in der Zubereitung praktisch keine Rolle, entscheidend ist allein die Wirkstoffgewichtsmenge pro Volumeneinheit Boden, welche in ppm (mg/l) angegeben wird. Man füllt den Boden in 0,25 l Töpfe und läßt diese bei 20°C stehen.

20 Sofort nach dem Ansatz werden je Topf 5 vorgekeimte Maiskörner der Sorte YIELD GUARD (Warenzeichen von Monsanto Comp., USA) gelegt. Nach 2 Tagen werden in den behandelten Boden die entsprechenden Testinsekten gesetzt. Nach weiteren 7 Tagen wird der Wirkungsgrad des Wirkstoffs durch Auszählen der aufgelaufenen
25 Maispflanzen bestimmt (1 Pflanze = 20 % Wirkung).

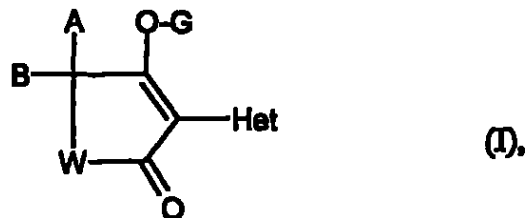
Beispiel I**Heliothis virescens - Test - Behandlung transgener Pflanzen**

- 5 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Aceton
Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

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

15 Sojabtriebe (Glycine max) der Sorte Roundup Ready (Warenzeichen der Monsanto Comp. USA) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit der Tabakknospenraupe *Heliothis virescens* besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung der Insekten bestimmt.

Patentansprüche**1. Verbindungen der Formel (I)**

5

in welcher

W für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) steht,

10 Het für jeweils gegebenenfalls substituiertes Thiazolyl, Oxazolyl oder Pyrazolyl steht,

15 A für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls mindestens ein Ringatom durch ein Heteroatom ersetzt ist, oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,

20

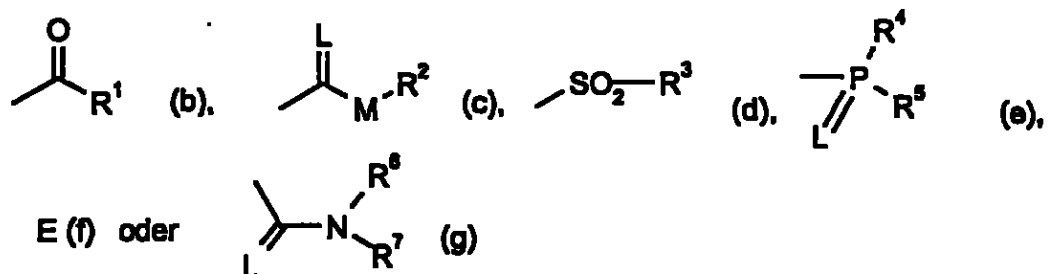
B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, oder

25 A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind für einen gesättigten oder ungesättigten, gegebenenfalls mindestens ein Heteroatom enthaltenden unsubstituierten oder substituierten Cyclus stehen,

D für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eines oder mehrere Ringglieder durch Heteroatome ersetzt sind, Arylalkyl, Aryl, Hetarylalkyl oder Hetaryl steht oder

A und D gemeinsam mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen gesättigten oder ungesättigten und gegebenenfalls mindestens ein Heteroatom enthaltenden, im A,D-Teil unsubstituierten oder substituierten Cyclus stehen,

G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



steht,

worin

E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht,

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl oder

gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl oder Alkoxy substituiertes Cycloalkyl, das durch mindestens ein Heteroatom unterbrochen sein kann, jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenylalkyl, Hetaryl, Phenoxyalkyl oder Hetaryloxyalkyl steht,

R^2 für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl steht,

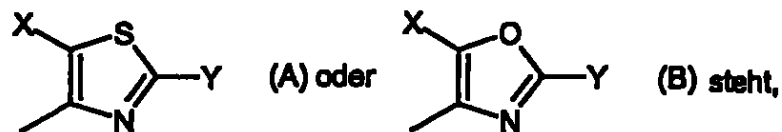
R^3 für Alkyl, Halogenalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

R^4 und R^5 unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylthio, Alkenylthio, Cycloalkylthio und für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenoxy oder Phenylthio stehen,

R^6 und R^7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, für gegebenenfalls substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls substituiertes Benzyl stehen, oder gemeinsam mit dem N-Atom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch Sauerstoff oder Schwefel unterbrochenen Cyclus stehen.

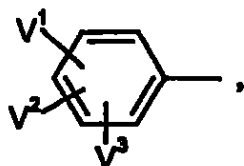
2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

Het für

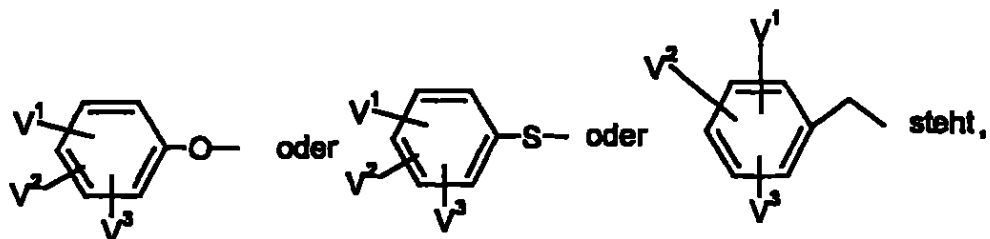


X für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, Nitro oder Cyano steht,

Y für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylsulfoxinyl oder für die Gruppe



oder im Falle von Het = Thiazolyl ((I-1-A) bis (I-3-A)) auch für



worin

V¹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano, Phenoxy oder jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenoxy-C₁-C₄-alkyl,

Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkylthio steht,

5 V² und V³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy stehen,

10 V¹ und V² zusammen gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind für einen gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituierten gesättigten oder ungesättigten 5- oder 6-gliedrigen Cyclus stehen, in welchem gegebenenfalls ein bis drei Kohlenstoffatome durch Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff ersetzt sein können,

15 W für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) steht,

20 A für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, Poly-C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes C₆- oder C₁₀-Aryl, Hetaryl mit 5 bis 6 Ringatomen oder C₆- oder C₁₀-Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,

30 B für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl steht, oder

A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₃-C₁₀-Cycloalkyl oder ungesättigtes C₅-C₁₀-Cycloalkyl stehen, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welche gegebenenfalls einfach oder zweifach durch C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, Halogen oder Phenyl substituiert sind oder

10 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₅-C₆-Cycloalkyl stehen, welches durch eine gegebenenfalls ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthaltende Alkylendiyl-, oder durch eine Alkylendioxy- oder durch eine Alkylendithioyl-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- bis sechsgliedrigen Ring bildet der gegebenenfalls einfach bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, oder

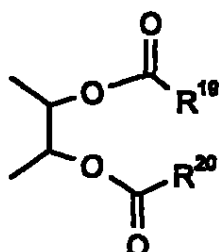
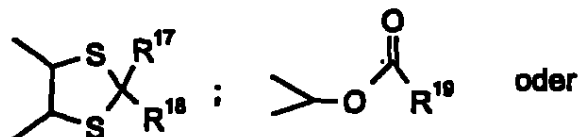
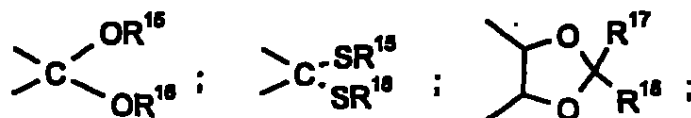
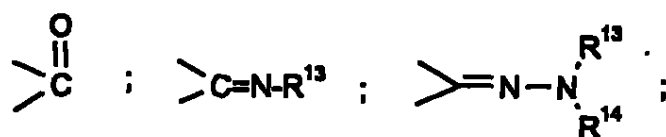
A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₅-C₈-Cycloalkenyl stehen, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder Halogen substituiertes C₂-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl oder C₄-C₆-Alkandiendiyl stehen, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

D für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder Cyano
25 substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl,
C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-
C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-
Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₈-
30 Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff
oder Schwefel ersetzt ist oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen,
C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-

Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Hetaryl mit 5 oder 6 Ringatomen, Phenyl-C₁-C₆-alkyl oder Hetaryl-C₁-C₆-alkyl mit 5 oder 6 Ringatomen stehen, oder

- 5 A und D gemeinsam für jeweils gegebenenfalls substituiertes C₃-C₆-Alkandiyl oder C₃-C₆-Alkendiyl stehen, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe, Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und
- wobei als Substituenten jeweils in Frage kommen:
- 10 Halogen, Hydroxy, Mercapto oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyloxy, oder eine weitere C₃-C₆-Alkandiylgruppierung, C₃-C₆-Alkendiylgruppierung oder eine Butadienylgruppierung, die gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl substituiert ist oder in der gegebenenfalls zwei benachbarte Substituenten
- 15 mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen weiteren gesättigten oder ungesättigten Cyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden (im Fall der Verbindung der Formel (I-1-A) bis (I-1-B) stehen A und D dann gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind be-
- 20 spielsweise für die weiter unten genannten Gruppen AD-1 bis AD-10), der Sauerstoff oder Schwefel enthalten kann, oder worin gegebenenfalls eine der folgenden Gruppen

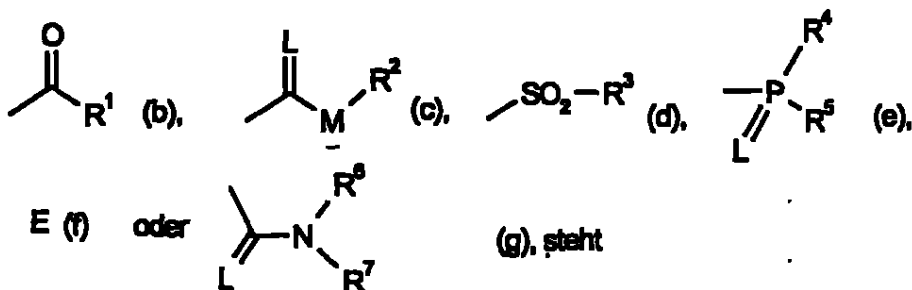
- 169 -



enthalten ist,

5

G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



in welchen

10

E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

5 R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₁-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder mehrere nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind,

10 für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl substituiertes Phenyl,

15 für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl-C₁-C₆-alkyl,

20 für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes 5- oder 6-gliedriges Hetaryl,

für gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiertes Phenoxy-C₁-C₆-alkyl oder

25 für gegebenenfalls durch Halogen, Amino oder C₁-C₆-Alkyl substituiertes 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy-C₁-C₆-alkyl steht,

30 R² für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl,

für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl in welchem gegebenenfalls ein Ringatom durch Sauerstoff ersetzt ist, oder

5 für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

10 R³ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

15 R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylamino, Di-(C₁-C₈-alkyl)amino, C₁-C₈-Alkylthio, C₂-C₈-Alkenylthio, C₃-C₇-Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio stehen,

20

25 R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Phenyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Benzyl oder zusammen für einen gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl substituierten C₃-C₆-Alkylrest stehen, in welchem gegebenenfalls ein Kohlenstoffatom durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

30

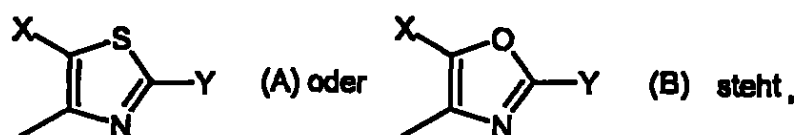
- 5 **R¹³** für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkoxy steht,
- 10 **R¹⁴** für Wasserstoff oder C₁-C₈-Alkyl steht oder
- R¹³ und R¹⁴** gemeinsam für C₄-C₆-Alkandiyl stehen,
- 15 **R¹⁵ und R¹⁶** gleich oder verschieden sind und für C₁-C₆-Alkyl stehen oder
- 20 **R¹⁵ und R¹⁶** gemeinsam für einen C₂-C₄-Alkandiylrest stehen, der gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder durch gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl substituiert ist,
- 25 **R¹⁷ und R¹⁸** unabhängig voneinander für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl stehen oder
- 30 **R¹⁷ und R¹⁸** gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für eine Carbonylgruppe oder für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₅-

C₇-Cycloalkyl stehen, in dem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

5 R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₁-C₁₀-Alkoxy, C₁-C₁₀-Alkylamino, C₃-C₁₀-Alkenylamino, Di-(C₁-C₁₀-alkyl)amino oder Di-(C₃-C₁₀-alkenyl)amino stehen.

3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

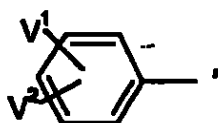
10 Het für



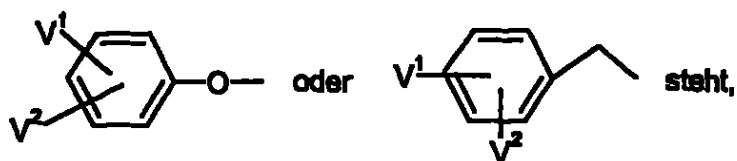
15 X für Wasserstoff, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, Nitro oder Cyano steht,

Y für Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder für die Gruppe

20



oder im Falle von Het = Thiazolyl ((I-1-A) bis (I-3-A)) auch für



25

worin

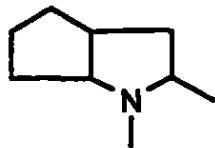
- 5 V¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano, Phenoxy oder jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenoxy-C₁-C₂-alkyl, Phenyl-C₁-C₂-alkoxy, Phenylthio-C₁-C₂-alkyl oder Phenyl-C₁-C₂-alkylthio steht,
- 10 V² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, oder
- 15 V¹ und V² zusammen gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind für einen gegebenenfalls durch Fluor oder Methyl substituierten 5- oder 6-gliedrigen Cyclus stehen, in welchem gegebenenfalls ein bis zwei Kohlenstoffatome durch Sauerstoff ersetzt sein können,
- 20 W für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) steht,
- 25 A für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Phenyl-C₁-C₂-alkyl steht,
- 30 B für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht, oder

- 5 A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₅-C₇-Cycloalkyl stehen, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach oder zweifach durch C₁-C₆-Alkyl, C₅-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Fluor, Chlor oder Phenyl substituiert ist oder
- 10 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₅-C₆-Cycloalkyl stehen, welches durch eine gegebenenfalls ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthaltende Alkylendiyl- oder durch eine Alkylen-dioxy- oder durch eine Alkylendithioyl-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- oder sechsgliedrigen Ring bildet der gegebenenfalls einfach bis dreifach durch C₁-C₃-Alkyl substituiert sein kann, oder
- 15 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₅-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl stehen, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₅-Alkoxy, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes C₂-C₄-Alkandiyl, C₂-C₄-Alken-diyl, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder Butadiendiyl stehen,
- 20 D für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl oder C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für jeweils gegebenenfalls
- 25 D für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl oder C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für jeweils gegebenenfalls
- 30 D für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl oder C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-

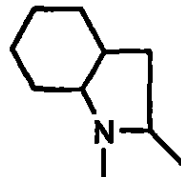
C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl, oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl steht, oder

- 5 A und D gemeinsam für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₅-Alkandiyl stehen, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe, Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein kann, wobei als Substituenten Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy in Frage kommen oder

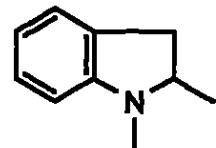
- 10 A und D gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für eine der Gruppen AD-1 bis AD-10 stehen:



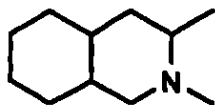
AD-1



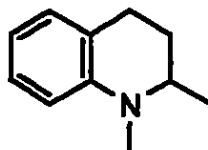
AD-2



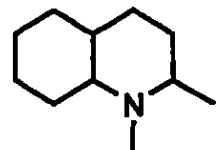
AD-3



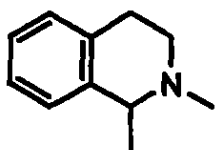
AD-4



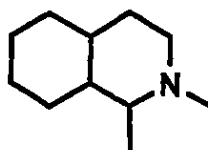
AD-5



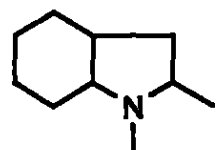
AD-6



AD-7

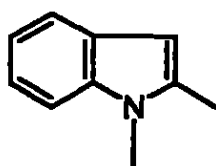


AD-8



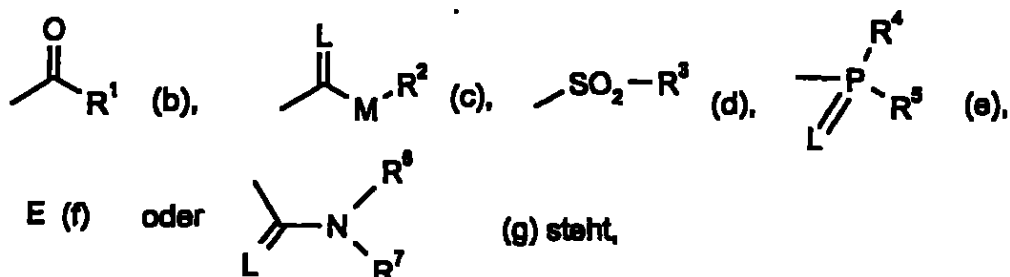
AD-9

- 177 -



AD-10

G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



in welchen

5

E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

10

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₅-Alkyl oder C₁-C₅-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind,

15

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Phenyl,

20

- für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl oder C₁-C₃-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl-C₁-C₄-alkyl,
- 5 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, Trifluormethyl oder C₁-C₂-Alkoxy substituiertes Pyrazolyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Furanyl oder Thienyl steht,
- 10 R² für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl,
- für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl oder
- 15 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
- 20 R³ für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl steht,
- 25 R⁴ für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₄-Alkenylthio, C₃-C₆-Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Halogenalkylthio, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio steht,
- 30 R⁵ für C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Alkylthio steht,

- 179 -

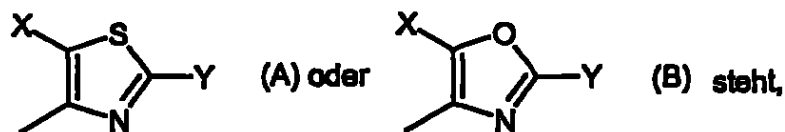
5 R^6 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C_1 - C_3 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_3 -Halogenalkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Benzyl steht,

10 R^7 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl steht, oder

R^6 und R^7 zusammen für einen gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl substituierten C_4 - C_5 -Alkylrest stehen, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

15 4. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

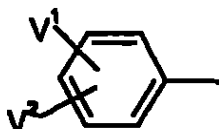
Het für



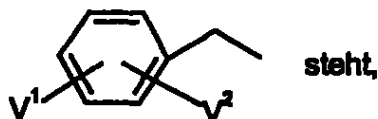
20

X für Wasserstoff, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl oder iso-Butyl steht,

25 Y für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl oder für die Gruppe



oder im Falle von Het = Thiazolyl ((I-1-A) bis (I-3-A)) auch für



steht,

worin

5

V¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Cyano, Phenoxy oder gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl steht,

10

V² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy steht, oder

15

V¹ und V² zusammen für -O-CH₂-O-, -O-CF₂-O- oder -O-CF₂-CF₂-O- stehen,

W für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) steht,

20

A für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Methyl, Ethyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl steht, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl,

25

30

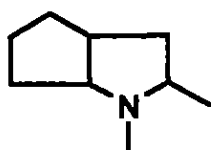
B für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht, oder

- 102
- 5 A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₅-C₆-Cycloalkyl stehen, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, iso-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Propoxy, iso-Propoxy, Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist oder
- 10 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₆-Cycloalkyl stehen, welches durch eine gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl einfach bis zweifach substituierte Alkylendioxy-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- oder sechsgliedrigen Ring bildet oder
- 15 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₅-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl stehen, worin zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für C₂-C₄-Alkandiyl oder C₂-C₄-Alkendiyl, worin jeweils gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder
- 20 Butadiendiyl stehen,
- 25 D für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₃-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₃-alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
- 30 oder

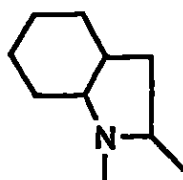
A und D gemeinsam für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl stehen, worin gegebenenfalls ein Kohlenstoffatom durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls durch Methyl substituiert ist oder

5

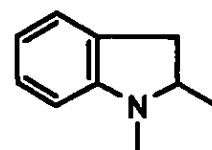
A und D (im Fall der Verbindungen der Formel (I-1)) gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für eine der folgenden Gruppen AD stehen:



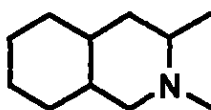
AD-1



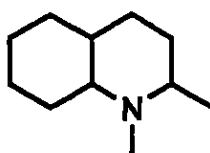
AD-2



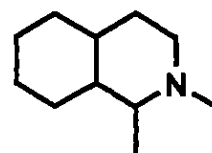
AD-3



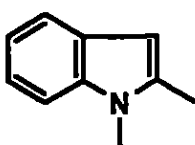
AD-4



AD-6



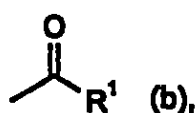
AD-8



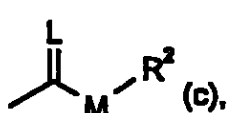
AD-10

10

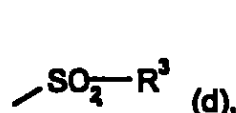
G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



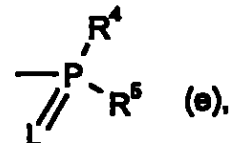
(b),



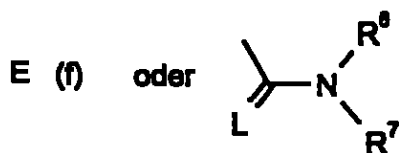
(c),



(d),



(e),



E (f) oder

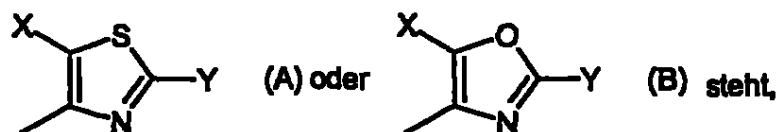
(g) steht,

in welchen

- E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,
- L für Sauerstoff oder Schwefel steht und
- 5 M für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₂-alkyl oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl oder Methoxy substituiertes Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,
- 10 für gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl,
- 15 für jeweils gegebenenfalls einfach durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiertes Thienyl oder Pyridyl steht,
- 20 R² für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₃-alkyl,
- 25 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl oder Methoxy substituiertes Cyclohexyl,
- oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
- 30

- 5 R^3 für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, tert.-Butyl, Methoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Cyano oder Nitro einfach substituiertes Phenyl steht,
- 10 R^4 für C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di-(C_1 - C_4 -alkyl)amino, C_1 - C_4 -Alkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C_1 - C_2 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Fluoralkoxy, C_1 - C_2 -Alkylthio, C_1 - C_2 -Fluoralkylthio oder C_1 - C_3 -Alkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio steht,
- 15 R^5 für Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio steht,
- 20 R^6 für C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_3 - C_4 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy substituiertes Benzyl steht,
- 25 R^7 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl oder Allyl steht, oder
- 30 R^6 und R^7 zusammen für einen C_5 - C_6 -Alkylrest stehen, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.
5. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

Het für

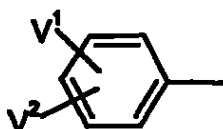


- 185 -

X für Wasserstoff, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, oder iso-Propyl steht,

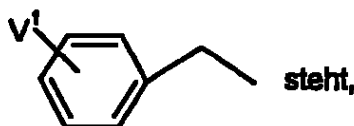
Y für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl oder für die Gruppe

5



oder im Fall von Het = Thiazolyl ((I-1-A) bis (I-3-A)) auch für

10



steht,

worin

V¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Phenoxy, für gegebenenfalls durch Chlor oder Trifluormethyl substituiertes Phenyl steht,

15

V² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Trifluormethyl steht, oder

20

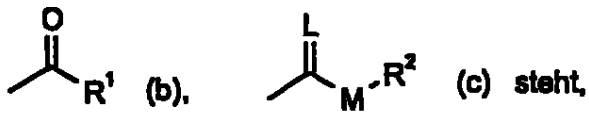
V¹ und V² zusammen für -O-CH₂-O- oder -O-CF₂-O- stehen,

W für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) steht,

25

A für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl oder Cyclopropyl steht,

B für Wasserstoff oder Methyl steht, oder

- 5 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₅-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Propoxy, Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist oder für C₅-C₆-Cycloalkyl stehen, worin zwei nicht direkt benachbarte Kohlenstoffatome einen weiteren fünfgliedrigen Ring bilden,
- 10 D für Wasserstoff steht,
- D auch für i-Propyl steht,
- 15 A und D zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für Cyclohexyl stehen, in welchem ein Ringatom durch Schwefel ersetzt sein kann,
- G für Wasserstoff (a) oder im Fall von Het = Thiazolyl (I-1-A) bis (I-3-A) für eine der Gruppen
- 20
- 

(b), (c) steht,
- in welchen
- 25 L für Sauerstoff steht und
- M für Sauerstoff steht,
- 30 R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₄-

105

- 187 -

Alkylthio-C₁-C₂-alkyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl oder Methoxy substituiertes Cyclopropyl oder Cyclohexyl,

5 für gegebenenfalls einfach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, tert.-Butoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl,

10 für jeweils gegebenenfalls einfach durch Chlor oder Methyl substituiertes Thienyl oder Pyridyl steht,

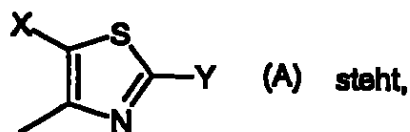
R² für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₃-alkyl,

15 für gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl oder Methoxy substituiertes Cyclohexyl,

20 oder für jeweils gegebenenfalls einfach durch Fluor, Chlor, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht.

6. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

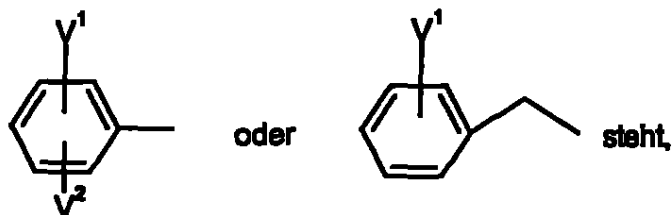
25 Het für



X für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, Chlor oder Brom steht,

30

Y für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl oder für die Gruppen



worin

5

V¹ für Wasserstoff, Brom, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Phenoxy oder t-Butyl oder für gegebenenfalls durch Chlor oder Trifluormethyl substituiertes Phenyl steht,

10

V² für Wasserstoff, Chlor, Fluor oder Methoxy steht oder

V¹ und V² zusammen für -O-CH₂-O- oder -O-CF₂-O- stehen,

15

W für N-D (1), Sauerstoff (2) oder Schwefel (3) steht,

D für Wasserstoff oder i-Propyl steht,

A für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl oder Cyclopropyl oder Wasserstoff steht,

20

B für Wasserstoff oder Methyl steht, oder

25

A und B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für Cyclohexyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringatom durch Sauerstoff ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiert ist oder für Cyclohexyl stehen, worin zwei nicht

direkt benachbarte Kohlenstoffatome einen weiteren 5-gliedrigen C-Ring bilden,

5 A und D zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für Cyclohexyl stehen, in welchem ein Ringatom durch Schwefel ersetzt sein kann,

G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen

10



worin

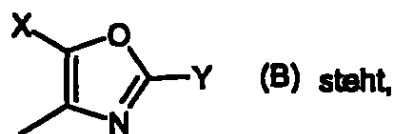
15 R¹ für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Chlor substituiertes Phenyl oder Pyridyl steht,

R² für Methyl, Ethyl, Phenyl, Benzyl, n- oder i-Propyl stehen.

7. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

20

Het für



25 X für Methyl oder Ethyl steht,

Y für gegebenenfalls durch Chlor substituiertes Phenyl steht,

- 190 -

A für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

B für Methyl steht, oder

5 A und B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, gemeinsam für Cyclohexyl stehen, welches gegebenenfalls durch Methoxy oder Methyl substituiert ist,

W für N-D oder Sauerstoff steht,

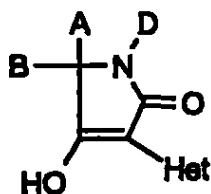
10

D für Wasserstoff steht,

G für Wasserstoff steht.

15 8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

(A) Verbindungen der Formel (I-1-A-a) bis (I-1-B-a)



(I-1-A-a) bis (I-1-B-a)

20

in welcher

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

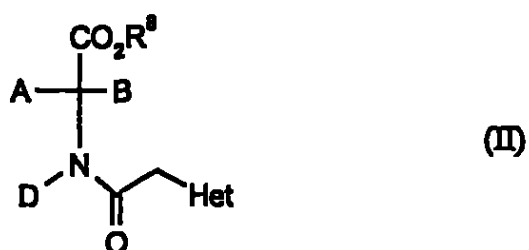
25

erhält, wenn man

Verbindungen der Formel (II)

107

- 191 -



in welcher

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

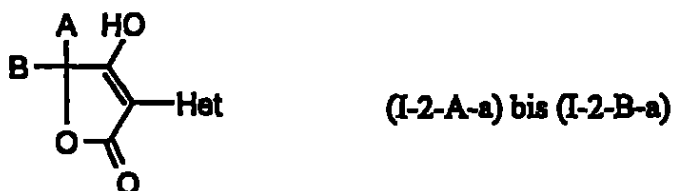
und

R^8 für Alkyl steht,

10

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert,

(B) Verbindungen der Formel (I-2-A-a) bis (I-2-B-a)



15

in welcher

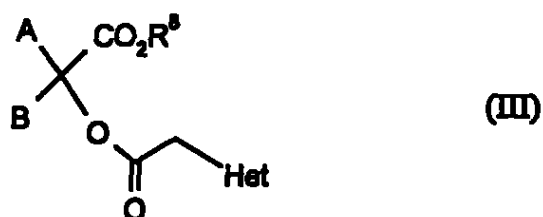
A, B und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

erhält, wenn man

Verbindungen der Formel (III)

- 192 -



in welcher

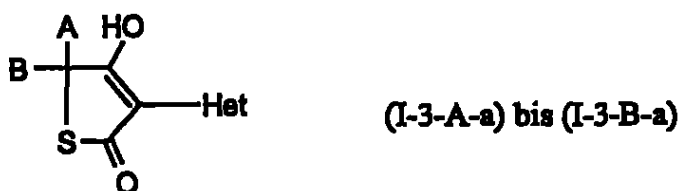
A, B, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert,

(C) Verbindungen der Formel (I-3-A-a) bis (I-3-B-a)

10



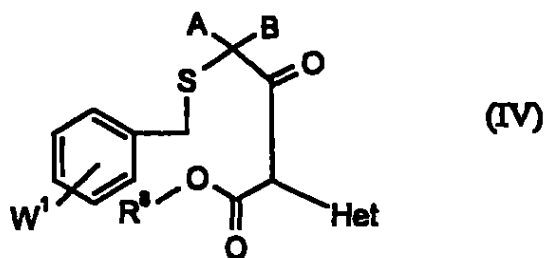
in welcher

A, B und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

erhält, wenn man

Verbindungen der Formel (IV)



20

in welcher

A, B, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

W¹ für Wasserstoff, Halogen, Alkyl oder Alkoxy steht,

5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Säure intramolekular cyclisiert,

10

und gegebenenfalls die so erhaltenen Verbindungen der Formeln (I-1-A-a) bis (I-3-B-a), in welcher

A, B, D und Het jeweils die oben angegebenen Bedeutungen haben,

jeweils

15

(D) (α) mit Säurehalogeniden der Formel (V)



in welcher

20

R¹ die oben angegebene Bedeutung hat und

Hal für Halogen steht

25

oder

(B) mit Carbonsäureanhydriden der Formel (VI)



30

in welcher

R^1 die oben angegebene Bedeutung hat,

5 gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und
gegebenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt;

(E) mit Chlorameisensäureestern oder Chlorameisensäurethioestern der
Formel (VII)

10



in welcher

15

R^2 und M die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
falls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt;

20

(F) mit Chlormonothioameisensäureestern oder Chlordithioameisensäure-
estern der Formel (VIII)



in welcher

25

M und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
falls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt

30

und

(G) mit Sulfonsäurechloriden der Formel (IX)



5

in welcher

R^3 die oben angegebene Bedeutung hat,

10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt,

(H) mit Phosphorverbindungen der Formel (X)



15

in welcher

L , R^4 und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben und

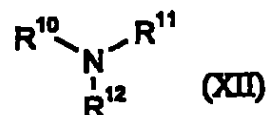
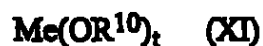
Hal für Halogen steht,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt,

(I) mit Metallverbindungen oder Aminen der Formeln (XI) oder (XII)

25



in welchen

Me für ein ein- oder zweiwertiges Metall,

t für die Zahl 1 oder 2 und

5 R^{10} , R^{11} , R^{12} unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Alkyl stehen,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

10 (J) (α) mit Isocyanaten oder Isothiocyanaten der Formel (XIII)



in welcher

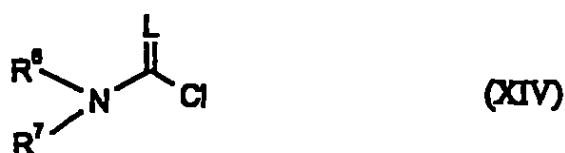
15

R^6 und L die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und
gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt oder

20

(β) mit Carbamidsäurechloriden oder Thiocarbamidsäurechloriden der Formel (XIV)



25

in welcher

L, R^6 und R^7 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und
gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels, umsetzt.

9. Verbindungen der Formel (II)

5

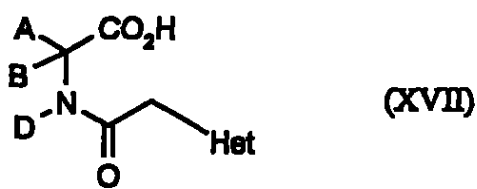


in welcher

A, B, D, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben.

10. Verbindungen der Formel (XVII)

10

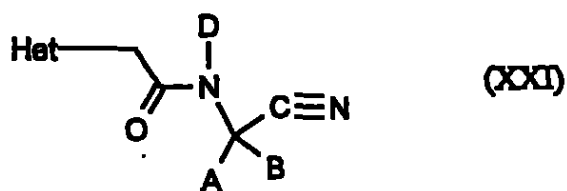


in welcher

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben.

11. Verbindungen der Formel (XXI)

15

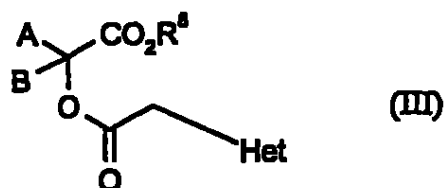


in welcher

A, B, D und Het die oben angegebenen Bedeutungen haben.

20

12. Verbindungen der Formel (III)

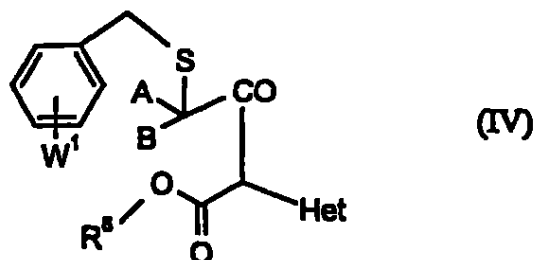


5 in welcher

A, B, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben.

13. Verbindungen der Formel (IV)

10



in welcher

A, B, W¹, Het und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben, und

15

W¹ für Wasserstoff, Halogen, Alkyl oder Alkoxy steht.

14. Schädlingsbekämpfungsmittel und Unkrautbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1.

20

15. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen und Unkräutern.

16. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen und Unkräutern, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt oder auf Unkräuter und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.

5

17. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln und Unkrautbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

10

18. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln und Unkrautbekämpfungsmitteln.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int. Application No.

PCT/EP 01/06174

112

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D417/04 A01N43/78

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)

IPC 7 C07D A01N

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 017 850 A (BAYER AG) 29 October 1980 (1980-10-29) Seiten 17 und 19, obere zwei Beispiele; Seite 18, oberes Beispiel; Seite 24, 13. Beispiel, Seite 25, 1. und 6. Beispiel	12
X	WO 99 32464 A (NOVARTIS ERFINDE VERWALT GMBH ;NOVARTIS AG (CH); ERTL PETER (CH); M) 1 July 1999 (1999-07-01) Tabelle 1, Beispiele-Nr. 1.3, 1.21	9, 12
A	US 4 377 588 A (CRAGOE JR EDWARD J ET AL) 22 March 1983 (1983-03-22) cited in the application Seite 9, "route III" claims 2,3	1-8

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in 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.

"A" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

2 October 2001

Date of mailing of the international search report

12/10/2001

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.O. 5618 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Schmid, A

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Int: al Application No

PCT/EP 01/06174

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0017850	A	29-10-1980	DE 2915026 A1	30-10-1980
			AR 226056 A1	31-05-1982
			AT 1944 T	15-12-1982
			AU 5732680 A	16-10-1980
			BR 8002253 A	02-12-1980
			CA 1145342 A1	26-04-1983
			CS 212230 B2	26-03-1982
			DD 150420 A5	02-09-1981
			DE 3061250 D1	13-01-1983
			DK 157280 A	13-10-1980
			EP 0017850 A1	29-10-1980
			ES 490484 D0	01-12-1980
			ES 8101039 A1	01-03-1981
			GR 68195 A1	10-11-1981
			JP 55141451 A	05-11-1980
			JP 63048862 B	30-09-1988
			NZ 193373 A	16-03-1982
			PL 223369 A1	13-02-1981
			PT 71051 A	01-05-1980
			ZA 8002185 A	27-05-1981
WO 9932464	A	01-07-1999	AU 2054699 A	12-07-1999
			BR 9814394 A	10-10-2000
			CN 1282324 T	31-01-2001
			WO 9932464 A1	01-07-1999
			EP 1042306 A1	11-10-2000
			HU 0100619 A2	28-06-2001
			PL 341290 A1	09-04-2001
			TR 200001740 T2	21-11-2000
			ZA 9811706 A	22-06-1999
US 4377588	A	22-03-1983	NONE	

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D417/04 A01N43/78

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

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

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

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitr. Anspruch Nr.
X	EP 0 017 850 A (BAYER AG) 29. Oktober 1980 (1980-10-29) Seiten 17 und 19, obere zwei Beispiele; Seite 18, oberes Beispiel; Seite 24, 13. Beispiel, Seite 25, 1. und 6. Beispiel	12
X	WO 99 32464 A (NOVARTIS ERFIND VERWALT GMBH ; NOVARTIS AG (CH); ERTL PETER (CH); M) 1. Juli 1999 (1999-07-01) Tabelle 1, Beispiele-Nr. 1.3, 1.21	9,12
A	US 4 377 588 A (CRAGOE JR EDWARD J ET AL) 22. März 1983 (1983-03-22) in der Anmeldung erwähnt Seite 9, "route III" Ansprüche 2,3	1-8

☐ 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 erfindertlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindertlicher 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 vorteilhaft ist

a Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

2. Oktober 2001

Abschließendes Datum des internationalen Recherchenberichts

12/10/2001

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.O. 5816 Patentamt 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Schmid, A

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Info des Abkürzungszeichens
PCT/EP 01/06174

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 0017850	A	29-10-1980	DE	2915026 A1	30-10-1980
			AR	226056 A1	31-05-1982
			AT	1944 T	15-12-1982
			AU	5732680 A	16-10-1980
			BR	8002253 A	02-12-1980
			CA	1145342 A1	26-04-1983
			CS	212230 B2	26-03-1982
			DD	150420 A5	02-09-1981
			DE	3061250 D1	13-01-1983
			DK	157280 A	13-10-1980
			EP	0017850 A1	29-10-1980
			ES	490484 D0	01-12-1980
			ES	8101039 A1	01-03-1981
			GR	68195 A1	10-11-1981
			JP	55141451 A	05-11-1980
			JP	63048862 B	30-09-1988
			NZ	193373 A	16-03-1982
			PL	223369 A1	13-02-1981
			PT	71051 A	01-05-1980
			ZA	8002185 A	27-05-1981
WO 9932464	A	01-07-1999	AU	2054699 A	12-07-1999
			BR	9814394 A	10-10-2000
			CN	1282324 T	31-01-2001
			WO	9932464 A1	01-07-1999
			EP	1042306 A1	11-10-2000
			HU	0100619 A2	28-06-2001
			PL	341290 A1	09-04-2001
			TR	200001740 T2	21-11-2000
US 4377588	A	22-03-1983	KEINE		

0	Vom Anmeldeamt auszufüllen	
0-1	Internationales Aktenzeichen.	
0-2	Internationales Anmeldedatum	
0-3	Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"	
0-4	Formular - PCT/RO/101 PCT-Antrag	
0-4-1	erstellt durch Benutzung von	PCT-EASY Version 2.91 (aktualisiert 01.01.2001)
0-5	Antragsersuchen Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird	
0-6	(Vom Anmelder gewähltes) Anmeldeamt	Europäisches Patentamt (EPA) (RO/EP)
0-7	Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	LEA34460-WO
I	Bezeichnung der Erfindung	HETARYLSUBSTITUIERTE HETEROCYCLEN
II	Anmelder	
II-1	Diese Person ist	nur Anmelder
II-2	Anmelder für	Alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US
II-4	Name	BAYER AKTIENGESELLSCHAFT
II-5	Anschrift:	D-51368 Leverkusen Deutschland
II-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
II-8	Telefonnr.	0214 30 71166
II-9	Telefaxnr.	0214 30 53482
III-1	Anmelder und/oder Erfinder	
III-1-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-1-2	Anmelder für	Nur US
III-1-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	FISCHER, Reiner
III-1-5	Anschrift:	Nelly-Sachs-Str. 23 D-40789 Monheim Deutschland
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

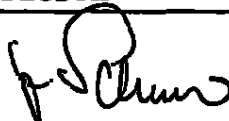
115

III-2	Anmelder und/oder Erfinder	
III-2-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-2-2	Anmelder für	Nur US
III-2-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	BRETSCHNEIDER, Thomas
III-2-5	Anschrift:	Talstr. 29b D-53797 Lobmar Deutschland
III-2-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-2-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-3	Anmelder und/oder Erfinder	
III-3-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-3-2	Anmelder für	Nur US
III-3-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	TRAUTWEIN, Axel
III-3-5	Anschrift:	~~Im Ahlemaier 23~~ Im Schild 15 D-51467 Bergisch Gladbach Deutschland
III-3-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-3-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-4	Anmelder und/oder Erfinder	
III-4-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-4-2	Anmelder für	Nur US
III-4-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ULLMANN, Astrid
III-4-5	Anschrift:	~~Merowingerstr. 31~~ D-50677 Köln Deutschland
III-4-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-4-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-5	Anmelder und/oder Erfinder	
III-5-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-5-2	Anmelder für	Nur US
III-5-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DREWES, Mark, Wilhelm
III-5-5	Anschrift:	Goethestr. 38 D-40764 Langenfeld Deutschland
III-5-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-5-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-6	Anmelder und/oder Erfinder	
III-6-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-6-2	Anmelder für	Nur US
III-6-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ERDELEN, Christoph
III-6-5	Anschrift:	Unterbüscherhof 15 D-42799 Leichlingen Deutschland
III-6-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-6-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

III-7	Anmelder und/oder Erfinder	
III-7-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-7-2	Anmelder für	Nur US
III-7-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DAHMEN, Pater
III-7-5	Anschrift:	Altebrücker Str. 61 D-41470 Neuss Deutschland
III-7-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-7-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-8	Anmelder und/oder Erfinder	
III-8-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-8-2	Anmelder für	Nur US
III-8-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	FEUCHT, Dieter
III-8-5	Anschrift:	Ackerweg 9 D-40789 Monheim Deutschland
III-8-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-8-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-9	Anmelder und/oder Erfinder	
III-9-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-9-2	Anmelder für	Nur US
III-9-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	PONTZEN, Rolf
III-9-5	Anschrift:	Am Kloster 69 D-42799 Leichlingen Deutschland
III-9-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-9-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
IV-1	Anwalt oder gemeinsamer Vertreter; oder besondere Zustellanschrift Die unten bezeichnete Person ist/wird hiermit bestellt, um den (die) Anmelder vor den internationalen Behörden zu vertreten, und zwar als:	gemeinsamer Vertreter
IV-1-1	Name	BAYER AKTIENGESELLSCHAFT
IV-1-2	Anschrift:	D-51368 Leverkusen Deutschland
IV-1-3	Telefonnr.	0214 30 71166
IV-1-4	Telefaxnr.	0214 30 53482

117

V	Bestimmung von Staaten	
V-1	Regionales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AP: GH GM KE LS MW MZ SD SL SZ TZ UG ZW und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat des Harare-Protokolls und Vertragsstaat des PCT ist EA: AM AZ BY KG KZ MD RU TJ TM und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Eurasischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist EP: AT BE CH&LI CY DE DK ES FI FR GB GR IE IT LU MC NL PT SE TR und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Europäischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist OA: BF BJ CF CG CI CM GA GN GW ML MR NE SN TD TG und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat der OAPI und Vertragsstaat des PCT ist
V-2	Nationales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AE AG AL AM AT AU AZ BA BB BG BR BY BZ CA CH&LI CN CR CU CZ DE DK DM DZ EE ES FI GB GD GE GH GM HR HU ID IL IN IS JP KE KG KP KR KZ LC LK LR LS LT LU LV MA MD MG MK MN MW MX MZ NO NZ PL PT RO RU SD SE SG SI SK SL TJ TM TR TT TZ UA UG US UZ VN YU ZA ZW
V-3	Nationales Patent (Staaten, die dem PCT nach Veröffentlichung dieser PCT-EASY-Version beigetreten sind.)	und alle weiteren Staaten, die am Anmeldetag dem PCT angehören.
V-5	Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen Zusätzlich zu den unter Punkten V-1, V-2 und V-3 vorgenommenen Bestimmungen nimmt der Anmelder nach Regel 4.9 Absatz b auch alle anderen nach dem PCT zulässigen Bestimmungen vor mit Ausnahme der nachstehend unter Punkt V-6 angegebenen Staaten. Der Anmelder erklärt, daß diese zusätzlichen Bestimmungen unter dem Vorbehalt einer Bestätigung stehen und jede zusätzliche Bestimmung, die vor Ablauf von 15 Monaten ab dem Prioritätsdatum nicht bestätigt wurde, nach Ablauf dieser Frist als vom Anmelder zurückgenommen gilt.	
V-6	Staaten, die von der Erklärung über vorsorgliche Bestimmungen ausgenommen werden	KEINE
VI-1	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht	
VI-1-1	Anmeldedatum	13 Juni 2000 (13.06.2000)
VI-1-2	Aktenzeichen	10029077.9
VI-1-3	Staat	DE

VII-1	Gewählte Internationale Recherchenbehörde	Europäisches Patentamt (EPA) (ISA/EP)	
VIII	Kontrollliste	Anzahl der Blätter	Elektronische Datei(en) beigelegt
VIII-1	Antrag	5	-
VIII-2	Beschreibung	161	-
VIII-3	Ansprüche	38	-
VIII-4	Zusammenfassung	1	EZABST00.TXT
VIII-5	Zeichnung(en)	0	-
VIII-7	INSGESAMT	205	
	Beigelegte Unterlagen	Unterlage(n) in Papierform beigelegt	Elektronische Datei(en) beigelegt
VIII-8	Blatt für die Gebührenberechnung	✓	-
VIII-9	Gesonderte unterzeichnete Vollmacht	✓	-
VIII-12	Prioritätsbeleg(e)	Unterlage(n) VI-1	-
VIII-16	PCT-EASY-Diskette	-	Diskette
VIII-18	Nr. der Abb. der Zeichn., die mit der Zusammenf. veröffentlicht werden soll		
VIII-19	Sprache der Int. Anmeldung	Deutsch	
IX-1	Unterschrift des Anmelders oder Anwalts	 i.V. Gumbert	
IX-1-1	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	BAYER AKTIENGESELLSCHAFT	

ppa. Dr. Günter Schumacher i.V. Dr. Ulrike
VOM ANMELDEAMT AUSZUFÜLLEN Gumbert

10-1	Datum des tatsächlichen Eingangs dieser Internationalen Anmeldung	
10-2	Zeichnung(en):	
10-2-1	Eingegangen	
10-2-2	Nicht eingegangen	
10-3	Geändertes Eingangsdatum aufgrund nachträglich, jedoch fristgerecht eingeg. Unterlage(n) oder Zeichnung(en) zur Vervollständigung dieser Int. Anmeldung	
10-4	Datum des fristgerechten Eingangs der Berichtigung nach PCT Artikel 11(2)	
10-5	Internationale Recherchenbehörde	ISA/EP
10-6	Übermittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchegebühr, aufgeschoben	

VOM INTERNATIONALEN BÜRO AUSZUFÜLLEN

11-1	Datum des Eingangs des Aktenexemplars beim Internationalen Büro	

119

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS**

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts IE A 34 460-WO Gam	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 01/ 06174	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 31/05/2001	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 13/06/2000
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D417/04		
Anmelder BAYER AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. Der internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.

2. Dieser **BERICHT** umfaßt insgesamt 2 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☐ Außerdem liegen dem Bericht **ANLAGEN** bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften zum PCT)

Diese Anlagen umfassen insgesamt _____ Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben und die entsprechenden Seiten zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 16/10/2001	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 14/06/2002
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d Fax: (+49-89) 2399-4465	Bevollmächtigter Bediensteter TZSCHOPPE D A Tel. (+49-89) 2399 2828

Formblatt PCT/IPEA/409 (Deckblatt)(Juli 1998)



I. Grundlage des Berichts

Grundlage dieses Berichtes sind die Anmeldungsunterlagen in der ursprünglich eingereichten Fassung.

V. Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(II) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit

In Anbetracht der im internationalen Recherchenbericht angeführten Unterlagen wird festgestellt, daß die Erfindung, wie sie in mindestens einigen von den Ansprüchen gekennzeichnet ist, die in Artikel 33(1) PCT aufgeführten Kriterien allem Anschein nach nicht erfüllt, d.h. nicht als neu und/oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend anzusehen ist (siehe internationaler Recherchenbericht, insbesondere die mit X und/oder Y angeführten Unterlagen und die entsprechenden Anspruchsnummern).

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

121

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

7

Applicant's or agent's file reference LEA34460-WO	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP01/06174	International filing date (day/month/year) 31 May 2001 (31.05.01)	Priority date (day/month/year) 13 June 2000 (13.06.00)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 417/04		
Applicant BAYER AKTIENGESELLSCHAFT		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 2 sheets, including this cover sheet.

☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of _____ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 16 October 2001 (16.10.01)	Date of completion of this report 14 June 2002 (14.06.2002)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No. PCT/EP01/06174

122

I. Basis of the report

The basis of international preliminary examination report is the application as originally filed.

V. Reasoned statement under Rule 66.2(a)(ii) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability

In light of the documents cited in the international search report, it is considered that the invention as defined in at least some of the claims does not appear to meet the criteria mentioned in Article 33(1) PCT, i.e. does not appear to be novel and/or to involve an inventive step (see international search report, in particular the documents cited X and/or Y and corresponding claim references).

HETEROCICLOS HETARIL-SUBSTITUIDOS.**Campo de la invención**

La presente invención se refiere a nuevos heterociclos hetaril-substituidos, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo como pesticidas y herbicidas.

5

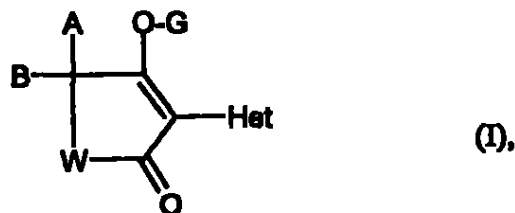
Descripción de la técnica anterior

Se conocen las 4-tiazolil-3-hidroxi-3-pirrolin-2,5-dionas como inhibidores de la oxidasa del ácido glicólico; US 4,296,237; US 4,377,588; EP-A-025 232; Rooney C.S. et al., J. Med. Chem. 26 700-714 (1983); Guzel Y. et al. THEOCHEM 366 131-137 (1996).

10

Descripción detallada de la invención

Se han encontrado ahora nuevos compuestos de la fórmula (I)



en la que

W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾,

15 Het significa tiazolilo, oxazolilo o pirazolilo substituidos respectivamente en caso dado,

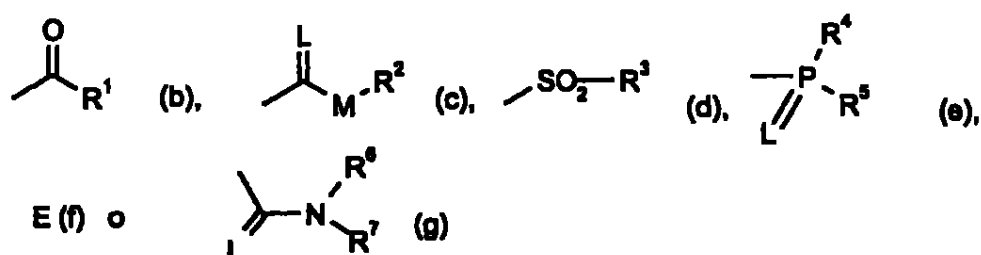
A significa hidrógeno, significa alquilo, alquenilo, alcoxialquilo, polialcoxialquilo, alquiltioalquilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, cicloalquilo saturado o insaturado, substituido en caso dado, en el

20 cual está reemplazado en caso dado al menos un átomo del anillo por un heteroátomo, o arilo, arilalquilo o hetarilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo, por halógenoalquilo, por alcoxi, por halógenoalcoxi, por ciano o por nitro,

B significa hidrógeno, alquilo o alcoxialquilo, o

D significa hidrógeno o significa un resto substituido en caso dado de la serie formada por alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxialquilo, polialcoxialquilo, alquiltioalquilo, cicloalquilo saturado o insaturado, en el cual están reemplazados en caso dado uno o varios miembros del anillo por heteroátomos, arilalquilo, arilo, hetarilalquilo o hetarilo o

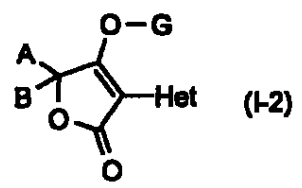
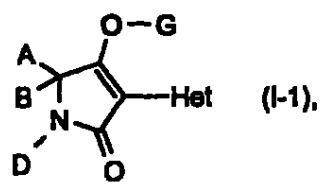
G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos

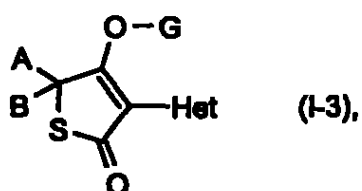


15 E significa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,
L significa oxígeno o azufre,
M significa oxígeno o azufre,
R¹ significa alquilo, alquenilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, polialcoxialquilo
20 substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o significan
cicloalquilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo o por alcoxi,
que puede estar interrumpido al menos por un heteroátomo fenilo,
fenilalquilo, hetarilo, fenoxialquilo o hetariloxialquilo substituidos
respectivamente en caso dado,
R² significa alquilo, alquenilo, alcoxialquilo, polialcoxialquilo substituidos

- respectivamente en caso dado por halógeno o significa cicloalquilo, fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R^3 significa alquilo, halógenoalquilo o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado,
- 5 R^4 y R^5 , independientemente entre sí, significan alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino, alquiltio, alqueniltio, cicloalquiltio substituidos respectivamente en caso dado por halógeno y significan fenilo, bencilo, fenoxi o feniltio substituidos respectivamente en caso dado,
- R^6 y R^7 independientemente entre sí significan hidrógeno, significan alquilo, 10 cicloalquilo, alquenilo, alcoxi, alcoxialquilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significan fenilo substituido en caso dado, significan bencilo substituido en caso dado o junto con el átomo de N, con el que están enlazados, significan un ciclo interrumpido en caso dado por oxígeno o por azufre.
- 15 Los compuestos de la fórmula (I) pueden presentarse, en función del tipo de los substituyentes, a modo de isómeros geométricos y/o ópticos o de mezclas de isómeros, de composición variable, que pueden separarse en caso dado de forma y manera usuales. Tanto los isómeros puros como también las mezclas de los isómeros, su obtención y empleo así como los agentes que les contienen constituyen el objeto
- 20 de la presente invención. A continuación se hablará siempre de los compuestos de la fórmula (I) con objeto de simplificar, aún cuando quieran indicarse tanto los compuestos puros como también, en caso dado, mezclas con proporciones variables de los compuestos isómeros.

Teniendo en consideración que $W = N-D^{(1)}$, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾, se 25 proporcionan las estructuras fundamentales siguientes (I-1) hasta (I-3):





donde

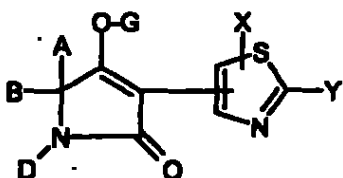
A, B, D y G tienen el significado anteriormente indicado y

Het significa tiazolilo u oxazolilo.

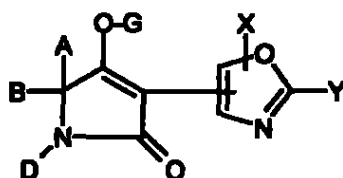
- 5 Teniendo en consideración los diversos significados de Het se producen las estructuras fundamentales siguientes:

(I-1-A) hasta (I-3-B) cuando W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾

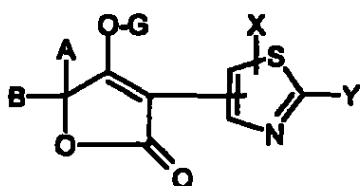
(I-1-A):



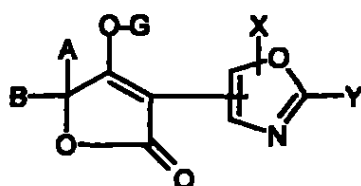
(I-1-B):



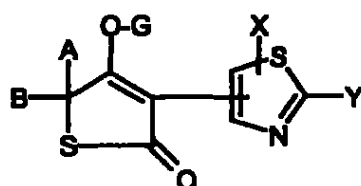
(I-2-A):



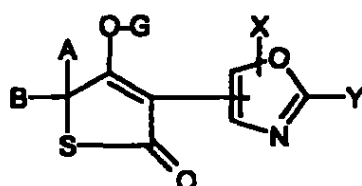
(I-2-B):



(I-3-A):



(I-3-B):



10

en la que

A, B, D y G tienen el significado anteriormente indicado y

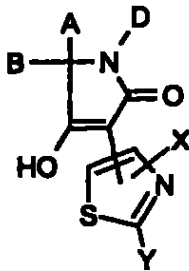
X significa hidrógeno, halógeno, alquilo, halógenoalquilo, alcoxi, halógenoalcoxi, alquenilo, halógenoalquenilo, nitro, ciano o fenilo

substituidos en caso dado,

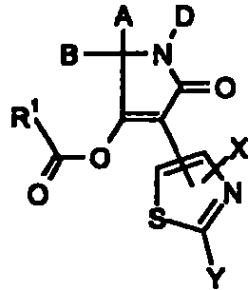
Y significa halógeno alquilo, halógenoalquilo, alcoxi, halógenoalcoxi; alquenilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfoxinilo, alquilsulfonilo o significa fenilo, bencilo, fenoxi o feniltio substituidos respectivamente en caso dado.

Teniendo en consideración los diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) y (g) del grupo G se producen las estructuras fundamentales siguientes (I-1-A-a), hasta (I-1-A-g) cuando W significa N-D⁽¹⁾,

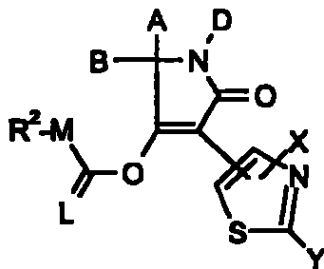
(I-1-A-a):



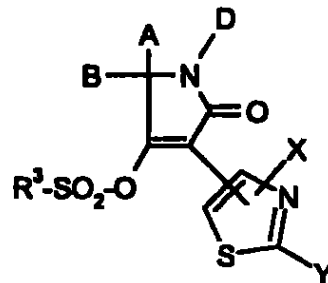
(I-1-A-b):



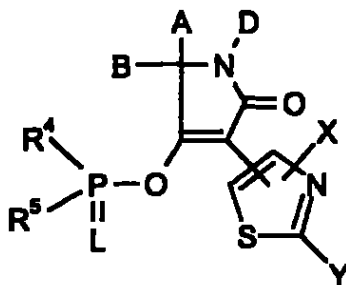
(I-1-A-c):



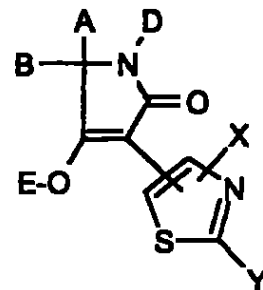
(I-1-A-d):



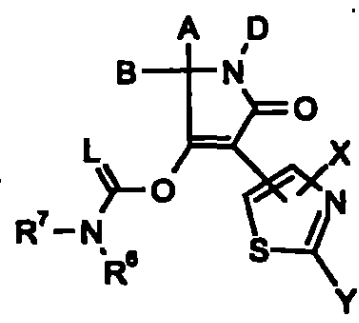
(I-1-A-e):



(I-1-A-f):



(I-1-A-g):

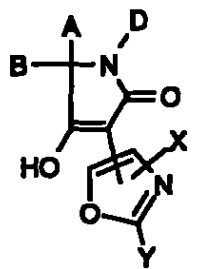


donde

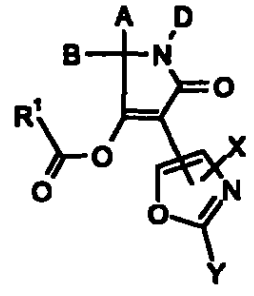
A, B, D, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ tienen los significados anteriormente indicados.

5 Teniendo en consideración los diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) y (g) del grupo G se producen las estructuras fundamentales siguientes (I-1-B-a) hasta (I-1-B-g) cuando W significa N-D⁽¹⁾,

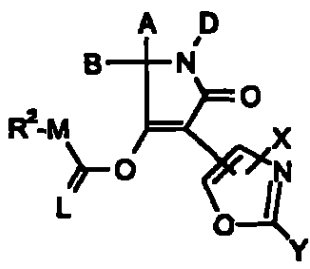
(I-1-B-a):



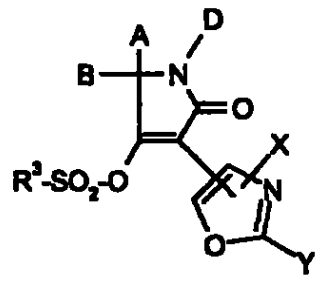
(I-1-B-b):



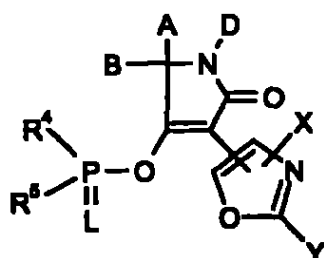
(I-1-B-c):



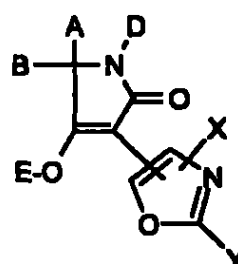
(I-1-B-d):



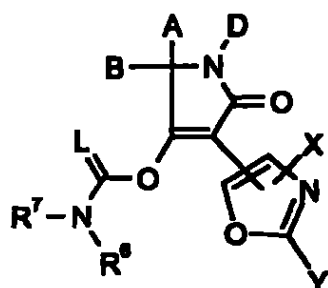
(I-1-B-e):



(I-1-B-f):



(I-1-B-g):



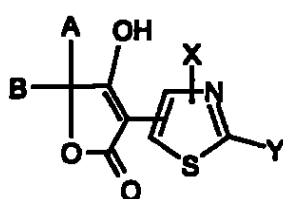
donde

A, B, D, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ tienen el significado anteriormente indicado.

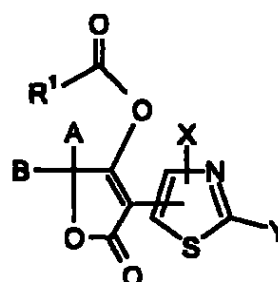
5

Teniendo en consideración los diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) y (g) del grupo G se producen las estructuras fundamentales siguientes (I-2-A-a) hasta (I-2-A-g), cuando W significa oxígeno⁽²⁾,

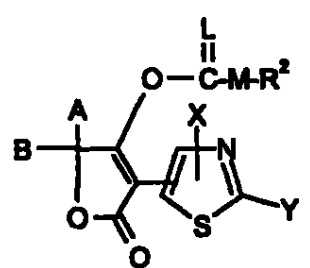
(I-2-A-a):



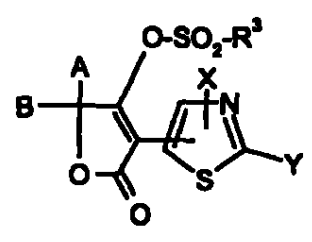
(I-2-A-b):



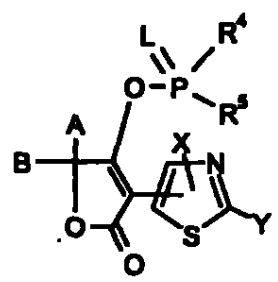
(I-2-A-c):



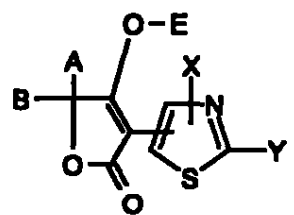
(I-2-A-d):



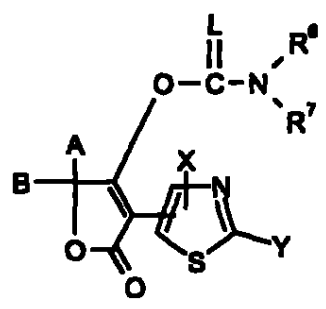
(I-2-A-e):



(I-2-A-f):



(I-2-A-g):

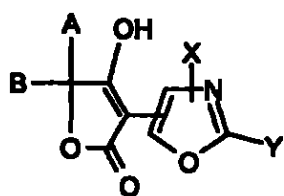


donde

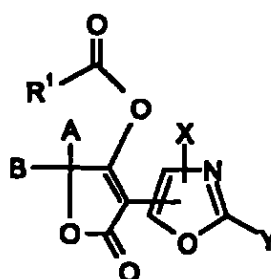
- 5 A, B, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ tienen el significado anteriormente indicado.

Teniendo en consideración los diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) y (g) del grupo G se producen las estructuras fundamentales siguientes (I-2-B-a) hasta (I-2-B-g), cuando W significa oxígeno⁽²⁾,

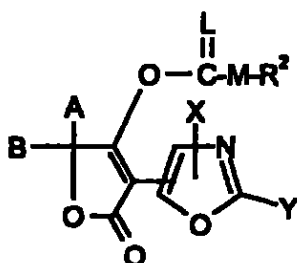
(1-2-B-a):



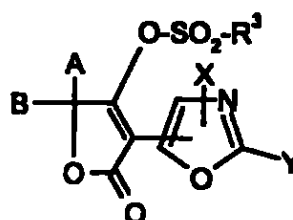
(1-2-B-b):



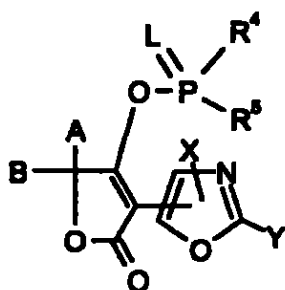
(1-2-B-c):



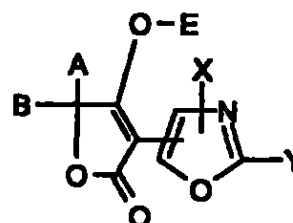
(1-2-B-d):



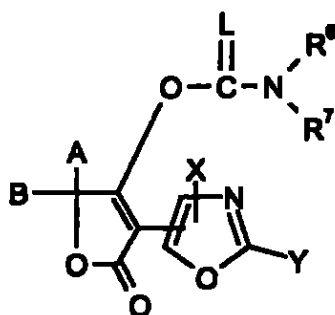
(1-2-B-e):



(1-2-B-f):



(1-2-B-g):



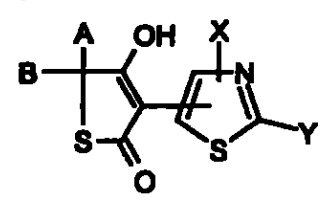
5 donde

A, B, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ tienen el significado anterior-

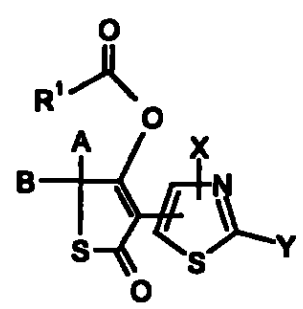
mente indicado.

Teniendo en consideración los diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) y (g) del grupo G se producen las estructuras fundamentales siguientes (I-3-A-a) hasta (I-3-A-g), cuando W significa azufre⁽³⁾,

(I-3-A-a):

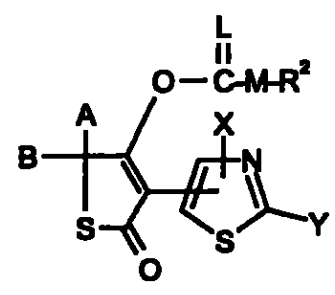


(I-3-A-b):

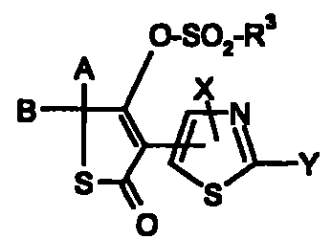


5

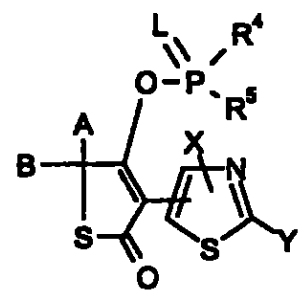
(I-3-A-c):



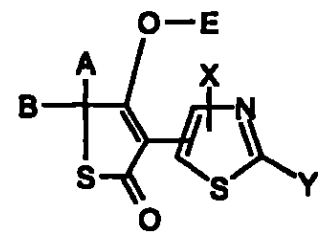
(I-3-A-d):



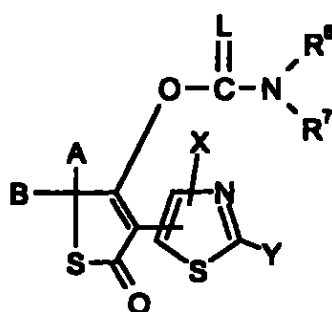
(I-3-A-e):



(I-3-A-f):



(I-3-A-g):

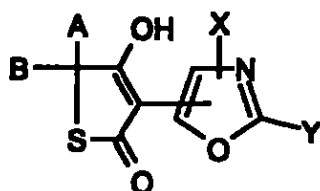


donde

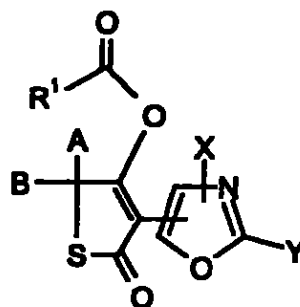
A, B, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ tienen el significado anteriormente indicado.

- 5 Teniendo en consideración los diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) y (g) del grupo G se producen las estructuras fundamentales siguientes (I-3-B-a) hasta (I-3-B-g) cuando W significa azufre⁽³⁾,

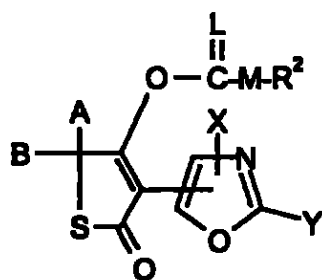
(I-3-B-a):



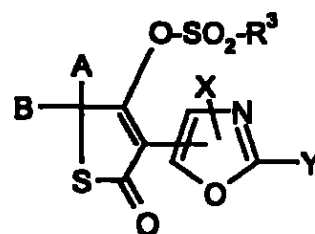
(I-3-B-b):



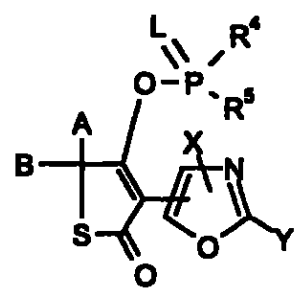
(I-3-B-c):



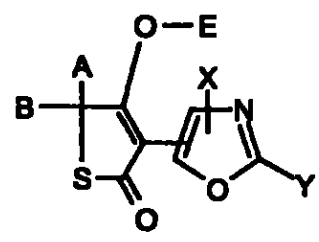
(I-3-B-d):



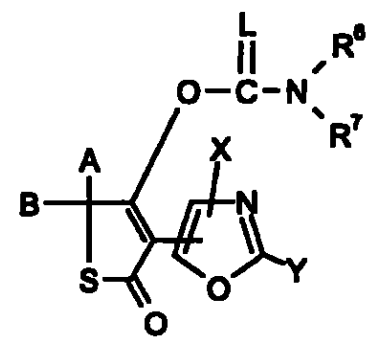
(I-3-B-e):



(I-3-B-f):



(I-3-B-g):

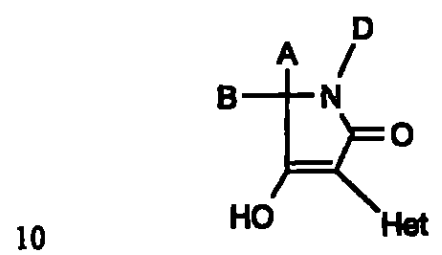


donde

5 A, B, E, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ tienen el significado anteriormente indicado.

Además se ha encontrado que se obtienen los nuevos compuestos de la fórmula (I) según uno de los procedimientos descritos a continuación:

(A) se obtienen las 3-hetaril-pirrolidin-2,4-dionas substituidas o bien sus enoles de la fórmula (I-1-A-a) hasta (I-1-B-a)

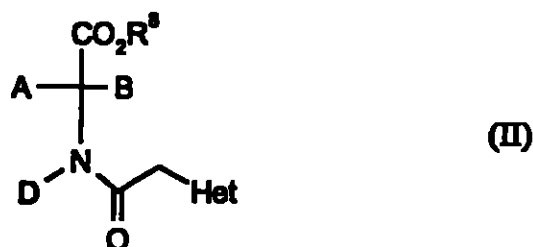


(I-1-A-a) hasta (I-1-B-a)

en la que

A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados,
si

se condensan intramolecularmente ésteres de los N-acilaminoácidos de la fórmula (II)

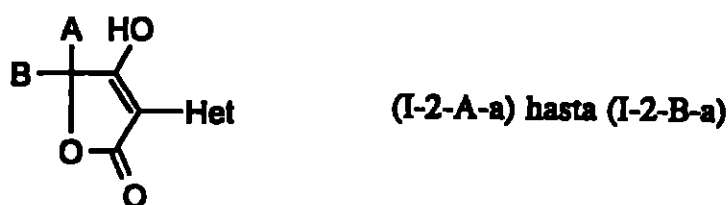


en la que

5 A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados, y

R^8 significa alquilo (preferentemente alquilo con 1 a 6 átomos de carbono),
en presencia de un diluyente y en presencia de una base.

(B) Además se ha encontrado que se obtienen los derivados de 3-aril-4-hidroxi- Δ^3 -dihidrofuranona de la fórmula (I-2-A-a) hasta (I-2-B-a)

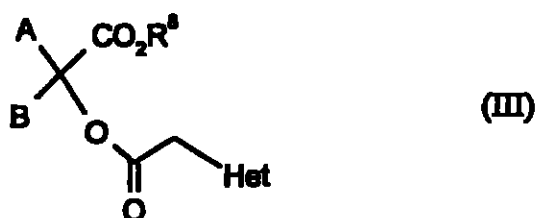


10

en la que

A, B y Het tienen los significados anteriormente indicados,
si

se condensan intramolecularmente ésteres de ácidos carboxílicos de la fórmula (III)

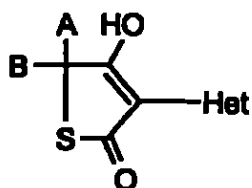


15

en la que

A, B, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados,
en presencia de un diluyente y en presencia de una base.

(C) Además se ha encontrado que se obtienen los derivados de la 3-aryl-4-hidroxi- Δ^3 -dihidrotiofen-2-ona de la fórmula (I-3-A-a) hasta (I-3-B-a)

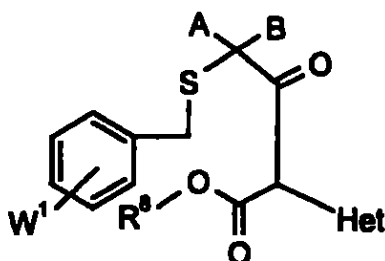


(I-3-A-a) hasta (I-3-B-a)

en la que

- 5 A, B y Het tienen los significados anteriormente indicados, si

se ciclan intramolecularmente ésteres de ácidos β -cetocarboxílicos de la fórmula (IV)



(IV)

en la que

- 10 A, B, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados y W^1 significa hidrógeno, halógeno, alquilo (preferentemente alquilo con 1 a 6 átomos de carbono) o alcoxi (preferentemente alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono),

en caso dado en presencia de un diluyente y en caso dado en presencia de un ácido.

- 15 Además se ha encontrado

(D) que se obtienen los compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-b) hasta (I-3-B-b), en las cuales A, B, D, R^1 y Het tienen los significados anteriormente indicados, si se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) en las cuales A, B, D y Het tienen

- 20 los significados anteriormente indicados, respectivamente

(α) con halogenuros de acilo de la fórmula (V)



en la que

R^1 tiene el significado anteriormente indicado y

5 Hal significa halógeno (especialmente cloro o bromo)

o

(β) con anhídridos de ácidos carboxílicos de la fórmula (VI)



en la que

10 R^1 tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido;

(E) que se obtienen los compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-c) hasta (I-3-B-c), en las cuales A, B, D, R^2 , M y Het tienen los significados

15 anteriormente indicados y L significa oxígeno, si se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a), en las cuales A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados, respectivamente

con ésteres del ácido clorofórmico o con tioésteres del ácido clorofórmico de la fórmula (VII)



en la que

R^2 y M tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un diluyente y en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido;

25 (F) que se obtienen los compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-c) hasta (I-3-B-c) en las cuales A, B, D, R^2 , M y Het tienen los significados

anteriormente indicados y L significa azufre, si se hacen reaccionar los compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) en las que A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados, respectivamente

5 con ésteres del ácido cloromonotiofórmico o con ésteres del ácido cloroditiofórmico de la fórmula (VIII)



en la que

M y R² tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido,

10

y

(G) que se obtienen los compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-d) hasta (I-3-B-d), en las cuales A, B, D, R³ y Het tienen los significados anteriormente indicados, si se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) en las cuales A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados, respectivamente con cloruros de sulfonilo de la fórmula (IX)

15



en la que

20 R³ tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido,

(H) que se obtienen los compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-e) hasta (I-3-B-e), en las cuales A, B, D, L, R⁴, R⁵ y Het tienen los significados anteriormente indicados, si se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a), en las cuales,

25

A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados, respectivamente

con compuestos del fósforo de la fórmula (X)



5 en la que

L, R⁴ y R⁵ tienen los significados anteriormente indicados y

Hal significa halógeno (especialmente cloro o bromo),

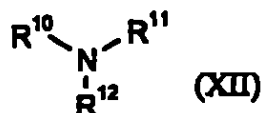
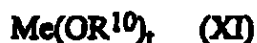
en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido,

10 (I) que se obtienen los compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-f) hasta (I-3-B-f), en las cuales A, B, D, E y Het tienen los significados anteriormente indicados,

si se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a), en las cuales A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados,

15 respectivamente

con compuestos metálicos o con aminas de las fórmulas (XI) o (XII)



en las cuales

20 Me significa un metal monovalente o divalente, (preferentemente un metal alcalino o alcalinotérreo tal como litio, sodio, potasio, magnesio o calcio),

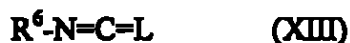
t significa el número 1 o 2 y

R¹⁰, R¹¹, R¹² independientemente entre sí, significan hidrógeno o alquilo (preferentemente alquilo con 1 a 8 átomos de carbono),

en caso dado en presencia de un diluyente,

- (J) que se obtienen los compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-g) hasta (I-3-B-g), en las cuales A, B, D, L, R⁶, R⁷ y Het tienen los significados anteriormente indicados, si se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas anteriormente indicadas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a), en las cuales A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados, respectivamente

- (α) con isocianatos o con isotiocianatos de la fórmula (XIII)



- 10 en la que

R⁶ y L tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un catalizador o

- (β) con cloruros de carbamidilo o con cloruros de tiocarbamidilo de la fórmula (XIV)



en la que

L, R⁶ y R⁷ tienen los significados anteriormente indicados,

- 20 en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido.

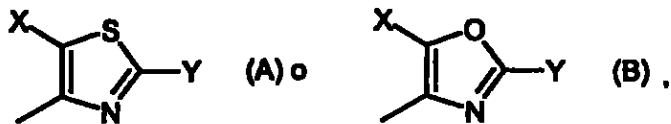
Además se ha encontrado que los nuevos compuestos de la fórmula (I) presentan una actividad muy buena como agentes pesticidas, preferentemente como insecticidas, acaricidas y herbicidas.

- 25 Los compuestos según la invención están definidos en general por medio de la fórmula (I). Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos indicados en las fórmulas citadas anteriormente y que se citarán a continuación, se

explican seguidamente:

Preferentemente,

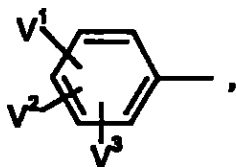
Het significa



5 preferentemente

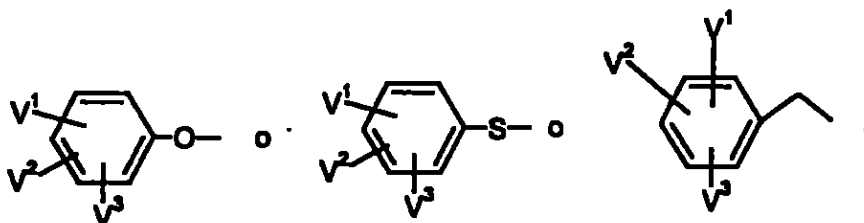
X significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi con 3 a 6 átomos de carbono, nitro o ciano, preferentemente,

10 Y significa halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfoxinilo con 1 a 6 átomos de carbono o significa el grupo



15

o en el caso en que Het = tiazolilo ((I-1-A) hasta (I-3-A)), significa también



preferentemente,

V¹ significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 12 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono,

20

- alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, nitro, ciano, fenoxi o significa fenilo, fenoxi, fenoxi-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, fenil-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, feniltio-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o fenil-alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado una o varias veces por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por nitro o por ciano, preferentemente,
- V^2 y V^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o preferentemente,
- V^1 y V^2 significan junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, un ciclo con 5 o 6 miembros saturado o insaturado, substituido en caso dado por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógeno, en el cual pueden estar reemplazados en caso dado de 1 a 3 átomos de carbono por oxígeno, por azufre o por nitrógeno, preferentemente,
- W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾.
Preferentemente,
- A significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 12 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, poli-alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 10 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de

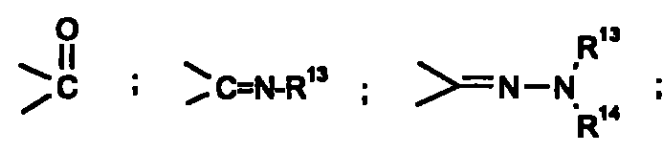
- 5 carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, en el cual están reemplazados en caso dado uno o dos miembros del anillo no directamente contiguos por oxígeno y/o por azufre o significa arilo con 6 o con 10 átomos de carbono (fenilo o naftilo), hetarilo con 5 a 6 átomos en el anillo (por ejemplo furanilo, piridilo, imidazolilo, triazolilo, pirazolilo, pirimidilo, tiazolilo o tienilo) o arilo con 6 o 10 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono (fenil-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o naftil-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono) substituidos respectivamente en caso dado por
- 10 halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por ciano o por nitro, preferentemente,
- 15 B significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o preferentemente,
- 20 A, B y el átomo de carbono con el que están enlazados significan cicloalquilo con 3 a 10 átomos de carbono saturado o cicloalquilo con 5 a 10 átomos de carbono insaturado, estando reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre y que está substituido en caso dado una o dos veces por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono, por halógeno o por fenilo o
- 25 preferentemente
- A, B y el átomo de carbono con el que están enlazados significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, que está substituido por un grupo alquilendiilo que contiene en caso 1 átomo de oxígeno o de azufre, o por un grupo alquilendioxilo o por un grupo alquilenditionilo, que forma con el átomo de

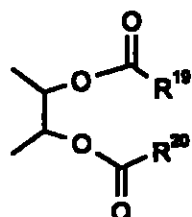
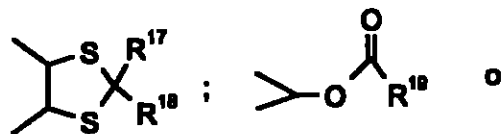
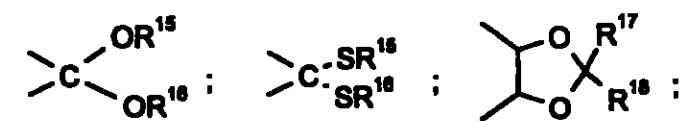
carbono, con el que está enlazado, otro anillo con 5 o 6 miembros que puede estar substituido, en caso dado, de una a cuatro veces, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o
preferentemente,

- 5 A, B y el átomo de carbono con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono o cicloalquenilo con 5 a 8 átomos de carbono, en el cual dos substituyentes junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, significan alcanodiilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquenodiilo con 2 a 6 átomos de carbono o alcanodiendiilo con 4 a 6 átomos de carbono
- 10 substituidos respectivamente en caso dado por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono o por halógeno, estando reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre, preferentemente,
- 15 D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 12 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 8 átomos de carbono, alquinilo con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 10 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, poli-alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 10 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o por ciano, significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por
- 20 alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre o significa fenilo, hetarilo con 5 o 6 átomos en el anillo (por ejemplo furanilo, imidazolilo, piridilo, tiazolilo, pirazolilo, pirimidilo, pirrolilo, tienilo o triazolilo), fenil-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o hetaril-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono con 5 o 6 átomos en el anillo (por ejemplo furanilo, imidazolilo, piridilo, tiazolilo, pirazolilo, pirimidilo, pirrolilo, tienilo o triazolilo) substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por
- 25

alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por ciano o por nitro o preferentemente,

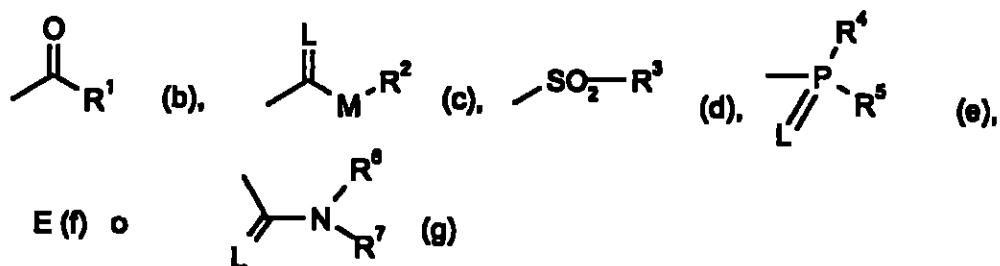
- 5 A y D significan conjuntamente alcanodiilo con 3 átomos de carbono o alquendiilo con 3 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado, estando reemplazado en caso dado un grupo metileno por un grupo carbonilo, por oxígeno o por azufre y entrando en consideración respectivamente como substituyentes:
- 10 halógeno, hidroxí, mercapto o alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono, fenilo o benciloxi substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, u otro agrupamiento alcanodiilo con 3 a 6 átomos de carbono, agrupamiento alquendiilo con 3 a 6 átomos de carbono o un agrupamiento butadienilo, que está substituido en caso dado por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o en el cual en caso dado dos substituyentes contiguos significan, junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, otro ciclo saturado o insaturado con 5 o 6 átomos en el anillo (en el caso de los compuestos de la fórmula (I-1-A) hasta (I-1-B), A y
- 15 D significan entonces junto con los átomos, con los que están enlazados, por ejemplo, los grupos citados a continuación AD-1 hasta AD-10), que puede contener oxígeno o azufre, o en el que está contenido en caso dado uno de los grupos siguientes
- 20





preferentemente,

5 G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos



especialmente significa (a), (b), (c) o (g),

en los cuales

E significa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,

10 L significa oxígeno o azufre y

M significa oxígeno o azufre,

preferentemente,

R¹ significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alqueno con 2 a 20 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 1 a 8 átomos de

15 carbono, alquiltio con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 1 a 8 átomos de

- carbono, poli-alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 1 a 8 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, en el cual están reemplazados en caso dado uno o varios (preferentemente no mas de dos) miembros del anillo no directamente contiguos por oxígeno y/o por azufre,
- 5 significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por ciano, por nitro, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono,
- 10 significa fenil-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno, por nitro, por ciano, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,
- 15 significa hetarilo con 5 o 6 miembros (por ejemplo pirazolilo, tiazolilo, piridilo, pirimidilo, furanilo o tienilo) substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,
- 20 significa fenoxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno o por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o significa hetariloxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, con 5 o 6 miembros (por ejemplo piridiloxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, pirimidiloxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o tiazoliloxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono), substituido en caso dado por halógeno, por amino, o por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,
- 25 preferentemente,
- R² significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 20 átomos

- de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, poli-alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno,
- 5 significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un átomo del anillo por oxígeno, o
- 10 significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por ciano, por nitro, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente,
- 15 R^3 significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por ciano o por nitro, preferentemente,
- 20 R^4 y R^5 significan, independientemente entre sí, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alquilamino con 1 a 8 átomos de carbono, di-(alquilo con 1 a 8 átomos de carbono)amino, alquiltio con 1 a 8 átomos de carbono, alqueniltio con 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil-tio con 3 a 7 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o significan fenilo, fenoxi o feniltio substituidos respectivamente en
- 25 caso dado por halógeno, por nitro, por ciano, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

preferentemente,

- R⁶ y R⁷** significan, independientemente entre sí, hidrógeno, significan alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 1 a 8 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significan fenilo substituido en caso dado por halógeno, por halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, por alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, significan bencilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono o en conjunto significan un resto alquileno con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está remplazado en caso dado un átomo de carbono por oxígeno o por azufre,
- R¹³** significan, preferentemente,
- significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre, o significa fenilo, fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o fenil-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por nitro o por ciano,
- preferentemente,
- R¹⁴** significa hidrógeno o alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o preferentemente,

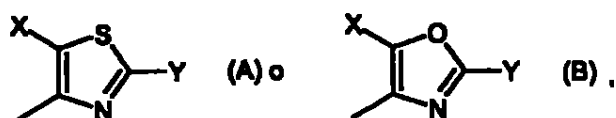
- R^{13} y R^{14} significan en conjunto alcanodiilo con 4 a 6 átomos de carbono, preferentemente,
- R^{15} y R^{16} son iguales o diferentes y significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o
- 5 preferentemente,
- R^{15} y R^{16} significan conjuntamente un resto alcanodiilo con 2 a 4 átomos de carbono, que está substituido en caso dado por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por
- 10 nitro o por ciano, preferentemente,
- R^{17} y R^{18} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, significan alquilo con 1 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno o significan fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por nitro o por ciano, o
- 15 preferentemente,
- R^{17} y R^{18} significan junto con el átomo de carbono, con el que están enlazados, un grupo carbonilo o significan cicloalquilo con 5 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está
- 20 reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre, preferentemente,
- R^{19} y R^{20} significan, independientemente entre sí, alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 10 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 10 átomos de carbono, alquilamino con 1 a 10 átomos de carbono, alquenilamino con 3 a 10
- 25

átomos de carbono, di-(alquilo con 1 a 10 átomos de carbono)amino o di-(alquenilo con 3 a 10 átomos de carbono)amino.

En las definiciones de los restos dadas como preferentes, halógeno significa flúor, cloro, bromo y yodo, especialmente significa flúor, cloro y bromo.

5 De forma especialmente preferente,

Het significa

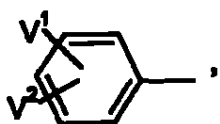


de forma especialmente preferente,

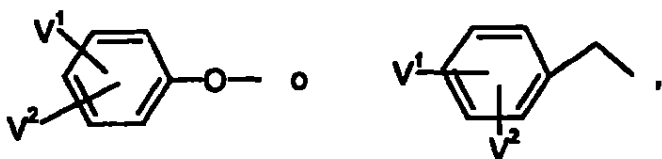
10 X significa hidrógeno, cloro, bromo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, nitro o ciano,

de forma especialmente preferente,

Y significa cloro, bromo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o significa el grupo



o en el caso en que Het = tiazolilo ((I-1-A) hasta (I-3-A)) significa también



de forma especialmente preferente,

20 V¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2

- átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, nitro, ciano, fenoxi o significa fenilo, fenoxi, fenoxi-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono, fenil-alcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, feniltio-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono o fenil-alquiltio con 1 a 2 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado una o dos veces por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, por nitro o por ciano, de forma especialmente preferente,
- 5
- 10 V^2 significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono o de forma especialmente preferente,
- 15 V^1 y V^2 significan junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, un ciclo con 5 o 6 miembros substituido en caso dado por flúor o por metilo, en el cual pueden estar reemplazados en caso dado 1 o 2 átomos de carbono por oxígeno, de forma especialmente preferente,
- 20 W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾, de forma especialmente preferente,
- A significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, significan cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre o significa fenilo o fenil-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4
- 25

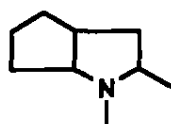
- átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, de forma especialmente preferente,
- 5 B significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o de forma especialmente preferente,
- 10 A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 7 átomos de carbono saturado, estando reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre y que está substituido en caso dado una o dos veces por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por flúor, por cloro o por fenilo, de forma especialmente preferente,
- 15 A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, que está substituido en caso dado por un grupo alquilendiilo, que contiene en caso dado un átomo de oxígeno o de azufre, o por un grupo alquilendioxilo o por un grupo alquilenditionilo, que forma con el átomo de carbono, con el que está enlazado, otro anillo de 5 o 6 miembros que puede estar substituido en caso dado de una a tres veces por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, o
- 20 de forma especialmente preferente,
- 25 A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono o cicloalquenilo con 5 a 6 átomos de carbono, en el cual dos substituyentes significan, junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, alcanodiilo con 2 a 4 átomos de carbono, alquenodiilo con 2 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por alquilo con 1 a 5 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 5 átomos de carbono, por flúor, por cloro o por bromo, estando reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre o significan butadiendiilo,

de forma especialmente preferente,

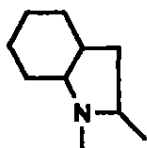
- D significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alqueno con 3 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 4 átomos de carbono o alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, significa cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre o significa fenilo o fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono o
- de forma especialmente preferente,

- A y D significan conjuntamente alcanodiilo con 3 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado, en el cual puede estar reemplazado en caso dado un grupo metileno por un grupo carbonilo, por oxígeno o por azufre, entrando en consideración como substituyentes hidroxilo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o
- de forma especialmente preferente,

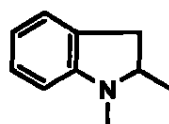
A y D significan junto con los átomos, con los que están enlazados, uno de los grupos AD-1 hasta AD-10:



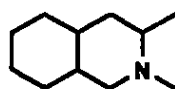
AD-1



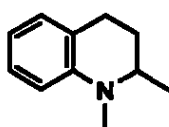
AD-2



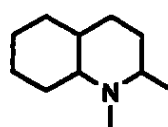
AD-3



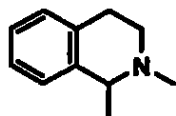
AD-4



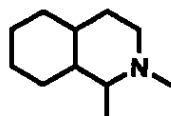
AD-5



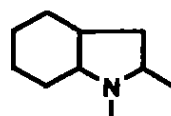
AD-6



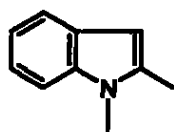
AD-7



AD-8



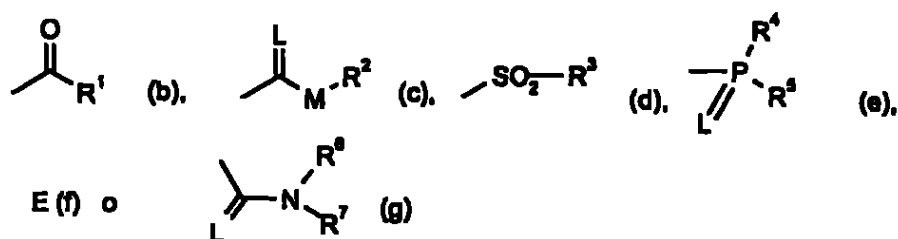
AD-9



AD-10

de forma especialmente preferente,

- 5 G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos



especialmente significa (a), (b), (c) o (g),

en los cuales

E significa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,

- 10 L significa oxígeno o azufre y

M significa oxígeno o azufre,

de forma especialmente preferente

R¹ significa alquilo con 1 a 16 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 16 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono sustituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro o

15

- significan cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por alquilo con 1 a 5 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 5 átomos de carbono, en el cual están reemplazados en caso dado uno o dos miembros del anillo, no directamente contiguos, por oxígeno y/o por
- 5 azufre,
- significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por nitro, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos
- 10 de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- significa fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono,
- 15 significa pirazolilo, tiazolilo, piridilo, pirimidilo, furanilo o tienilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por trifluórmethyl o por alcoxi con 1 a 2 átomos de carbono,
- de forma especialmente preferente,
- 20 R² significa alquilo con 1 a 16 átomos de carbono, alqueno con 2 a 16 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor,
- significa cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con
- 25 1 a 4 átomos de carbono o
- significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por nitro, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono,

de forma especialmente preferente,

- 5 **R³** significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor o significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por ciano o por nitro, de forma especialmente preferente,
- 10 **R⁴** significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino con 1 a 6 átomos de carbono, di-(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)amino, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono-alqueniltio con 3 a 4 átomos de carbono, cicloalquiltio con 3 a 6 átomos de carbono o significa fenilo, fenoxi o feniltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por nitro, por ciano, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono o por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, de forma especialmente preferente,
- 15 **R⁵** significa alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono o alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono, de forma especialmente preferente,
- 20 **R⁶** significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa bencilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de
- 25

carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,
de forma especialmente preferente,

R⁷ significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, o

5 de forma especialmente preferente,

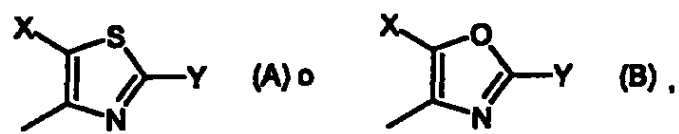
R⁶ y R⁷ significan conjuntamente un resto alquileo con 4 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por metilo o por etilo, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre.

En las definiciones de los restos citadas como especialmente preferentes,

10 halógeno significa flúor, cloro, bromo y yodo, especialmente significa flúor, cloro y bromo.

De forma muy especialmente preferente,

Het significa



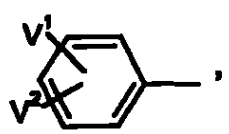
15 de forma muy especialmente preferente,

X significa hidrógeno, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo o iso-butilo,

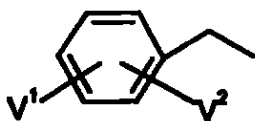
de forma muy especialmente preferente,

Y significa metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc.-butilo,

20 trifluórmétilo o significa el grupo



o en el caso en que Het = tiazolilo ((I-1-A) hasta (I-3-A)) significa también



de forma muy especialmente preferente,

V¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, trifluórmétilo, trifluórmetoxi, nitro, ciano, fenoxi o fenilo substituido en caso
5 dado una o dos veces por flúor, por cloro, por metilo, por metoxi, por trifluórmétilo o por trifluórmetoxi,

de forma muy especialmente preferente,

V² significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, metoxi, etoxi, trifluórmétilo o trifluórmetoxi, o
10

de forma muy especialmente preferente,

V¹ y V² significan conjuntamente -O-CH₂-O-, -O-CF₂-O- o -O-CF₂-CF₂-O-,
de forma muy especialmente preferente,

W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾,

15 de forma muy especialmente preferente,

A significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por metilo, por etilo o
20 por metoxi, en el cual está reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n-propilo, por iso-propilo, por terc.-butilo, por metoxi o por etoxi, por trifluórmétilo, por trifluórmetoxi, por ciano o por nitro,

25 de forma muy especialmente preferente,

B significa hidrógeno, metilo o etilo o

de forma muy especialmente preferente,

5 A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono saturado, en el cual está reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre y que está substituido en caso dado una o dos veces por metilo, por etilo, por propilo, por isopropilo, por butilo, por iso-butilo, por sec.-butilo, por terc.-butilo, por trifluormetilo, por metoxi, por etoxi, por propoxi, por iso-propoxi, por butoxi o por iso-butoxi o de forma muy especialmente preferente,

10 A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 6 átomos de carbono, que está substituido en caso dado por un grupo alquilendioxilo, substituido en caso dado una o dos veces por metilo o por etilo, que forma con el átomo de carbono, con el que está enlazado, otro anillo de 5 o 6 miembros o de forma muy especialmente preferente,

15 A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono o cicloalqueno con 5 a 6 átomos de carbono, significando dos substituyentes junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, alcanodiilo con 2 a 4 átomos de carbono o alquendiilo con 2 a 4 átomos de carbono, estando reemplazados respectivamente en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre, de forma muy especialmente preferente,

20 D significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alqueno con 3 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 2 a 3 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 2 a 3 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n-propilo, por iso-propilo, por metoxi, por

25

etoxi, por trifluormetilo o por trifluormetoxi,

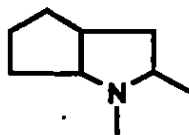
o

de forma muy especialmente preferente,

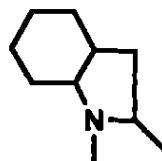
A y D significan conjuntamente alcanodiilo con 3 a 4 átomos de carbono substituido

5 en caso dado, estando reemplazado en caso dado un átomo de carbono por oxígeno o por azufre y está substituido, en caso dado, por metilo o de forma muy especialmente preferente,

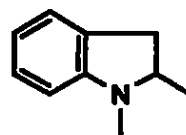
A y D significan junto con los átomos, con los que están enlazados, uno de los grupos AD siguientes:



AD-1

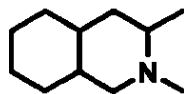


AD-2

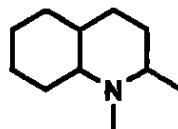


AD-3

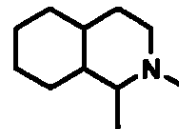
10



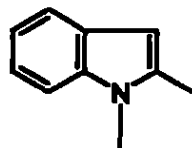
AD-4



AD-6



AD-8



AD-10

de forma muy especialmente preferente,

G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos



en los cuales

5 L significa oxígeno o azufre y

de forma muy especialmente preferente,

10

15

de forma muy especialmente preferente,

20

por etilo, por n-propilo, por iso-propilo o por metoxi,

o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por ciano, por nitro, por metilo, por etilo, por metoxi, por trifluórmétilo o por trifluórmétoxi.

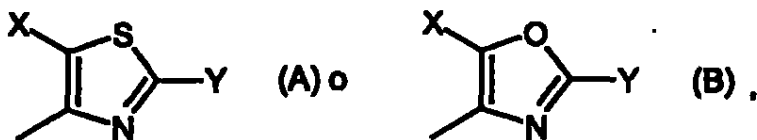
De forma muy especialmente preferente,

- 5 R³ significa metilo, etilo, n-propilo o fenilo monosubstituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por terc.-butilo, por metoxi, por trifluórmétilo, por trifluórmétoxi, por ciano o por nitro,
de forma muy especialmente preferente,
- 10 R⁴ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquilamino con 1 a 4 átomos de carbono, di-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)amino, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o significa fenilo, fenoxi o feniltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por nitro, por ciano, por alcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, por flúoralcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 2 átomos de carbono, por flúoralquiltio con 1 a 2 átomos de carbono o por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono,
de forma muy especialmente preferente,
- 15 R⁵ significa metoxi, etoxi, metiltio o etiltio,
de forma muy especialmente preferente,
- 20 R⁶ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por trifluórmétilo, por metilo o por metoxi, significa bencilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por trifluórmétilo o por metoxi,
de forma muy especialmente preferente,
- 25 R⁷ significa hidrógeno, metilo, etilo, propilo o alilo, o
de forma muy especialmente preferente,

R^6 y R^7 significan conjuntamente un resto alquileo con 5 a 6 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre.

Señaladamente,

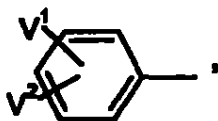
5 Het significa



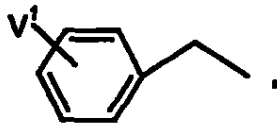
señaladamente,

X significa hidrógeno, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo, señaladamente,

10 Y significa metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, terc.-butilo, trifluórmétilo o significa el grupo



o en el caso en que Het = tiazolilo ((I-1-A) hasta (I-3-A)) o significa también



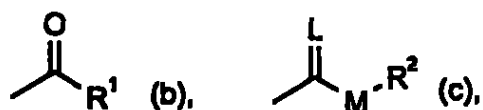
15 señaladamente,

V^1 significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, trifluórmétilo, trifluórmétoxi, fenoxi, significa fenilo substituido en caso dado por cloro o por trifluórmétilo,

20 señaladamente,

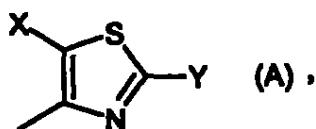
V^2 significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, etilo, metoxi o trifluórmétilo o

- señaladamente,
- V¹ y V² significan conjuntamente $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$ o $-\text{O}-\text{CF}_2-\text{O}-$,
señaladamente,
- W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾, o azufre⁽³⁾,
5 señaladamente,
- A significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o ciclopropilo,
señaladamente,
- B significa hidrógeno o metilo o
señaladamente,
- 10 A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, saturado, en el cual están reemplazados en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre y que está substituido en caso dado una o dos veces por metilo, por etilo, por propilo, por isopropilo, por trifluórmethyl, por metoxi, por etoxi, por propoxi, por butoxi o por iso-butoxi
15 o significa cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, formando 2 átomos de carbono no directamente contiguos otro anillo de cinco miembros,
señaladamente,
- D significa hidrógeno,
señaladamente,
- 20 D significa también i-propilo,
señaladamente,
- A y D significan junto con los átomos, con los que están enlazados, ciclohexilo, en el que puede estar reemplazado un átomo del anillo por azufre,
señaladamente,
- 25 G significa hidrógeno (a) o en el caso en que Het = tiazolilo (I-1-A) hasta (I-3-A), significa también los grupos



en los cuales

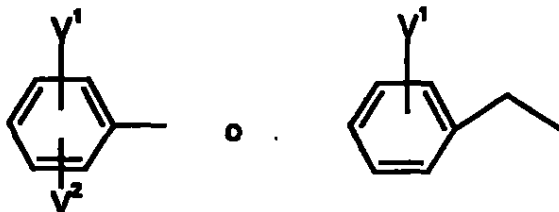
- L significa oxígeno y
- M significa oxígeno,
 señaladamente,
- 5 R¹ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de
 carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átomos de
 carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átomos de
 carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro o
 significan ciclopropilo o ciclohexilo substituidos en caso dado por flúor, por
10 cloro, por metilo, por etilo o por metoxi,
 significa fenilo monosubstituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo,
 por ciano, por nitro, por metilo, por etilo, por n-propilo, por i-propilo, por
 terc.-butilo, por metoxi, por etoxi, por i-propoxi, por terc.-butoxi, por
 trifluóormetilo o por trifluóormetoxi,
- 15 significa tienilo o piridilo monosubstituidos respectivamente en caso dado por
 cloro o por metilo,
 señaladamente,
- R² significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de
 carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 2 a 3 átomos de
20 carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor,
 significa ciclohexilo substituido en caso dado por metilo, por etilo, por n-
 propilo, por iso-propilo o por metoxi,
 o significa fenilo o bencilo monosubstituidos respectivamente en caso dado
 por flúor, por cloro, por ciano, por nitro, por metilo, por etilo, por metoxi, por
25 trifluóormetilo o por trifluóormetoxi,
 de manera especialmente preferente,
- Het significa



de manera especialmente preferente,

X significa metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, cloro o bromo,
de manera especialmente preferente,

5 Y significa metilo, etilo, n-propilo o i-propilo o significa los grupos



en los cuales

de manera especialmente preferente,

V¹ significa hidrógeno, bromo, cloro, metilo, trifluórmétilo, fenoxi o t-butoxi o

10 significa fenilo substituido en caso dado por cloro o por trifluórmétilo,
de forma especialmente preferente,

V² significa hidrógeno, cloro, flúor o metoxi o

de forma especialmente preferente,

V¹ y V² significan conjuntamente -O-CH₂-O- o -O-CF₂-O-,

15 de manera especialmente preferente,

W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾,

de forma especialmente preferente,

D significa hidrógeno o i-propilo (especialmente significa hidrógeno),

de manera especialmente preferente,

20 A significa metilo, etilo, n- o i-propilo o ciclopropilo o hidrógeno
(especialmente significa metilo),

de manera especialmente preferente,

B significa hidrógeno o metilo o

de manera especialmente preferente,

- A y B y el átomo, con el que están enlazados, significan ciclohexilo, en el que está reemplazado en caso dado un átomo del anillo por oxígeno y que está substituido en caso dado una o dos veces por metilo, por etilo, por metoxi o por etoxi o significa ciclohexilo, formando 2 átomos de carbono, no directamente contiguos, otro anillo con 5 miembros, de forma especialmente preferente,

- A y D significan junto con los átomos, con los que están enlazados, ciclohexilo, en el que puede estar reemplazado un átomo del anillo por azufre, de forma especialmente preferente,

G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos



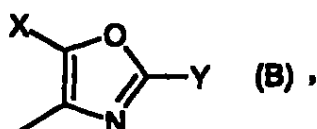
donde

- de forma especialmente preferente,
- 15 R^1 significa metilo, etilo, n-propilo o i-propilo o significa fenilo o piridilo substituidos respectivamente en caso dado por cloro, de forma especialmente preferente,

R^2 significa metilo, etilo, fenilo, bencilo, n- o i-propilo.

De forma especialmente preferente,

- 20 Het significa



de forma especialmente preferente,

- X significa metilo o etilo, de forma especialmente preferente,

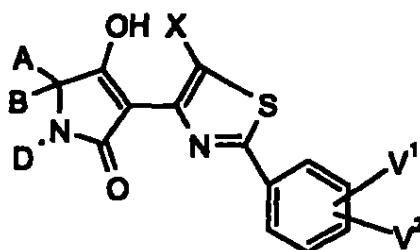
- Y significa fenilo substituido en caso dado por cloro,
de forma especialmente preferente,
- A significa metilo, etilo, n- o i-propilo,
de forma especialmente preferente,
- 5 B significa metilo, o
de forma especialmente preferente,
- A y B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan ciclohexilo, que
está substituido en caso dado por metoxi o por metilo,
de forma especialmente preferente,
- 10 W significa N-D u oxígeno,
de forma especialmente preferente,
- D significa hidrógeno,
de forma especialmente preferente,
- G significa hidrógeno.
- 15 Las definiciones de los restos o bien las explicaciones indicadas
anteriormente de manera general o citadas en los intervalos preferentes pueden
combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos respectivos y
los intervalos preferentes. Estas son válidas para los productos finales así como, de
manera correspondiente, para los productos de partida y para los productos
- 20 intermedios.
- Serán preferentes según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los
que se presente una combinación de los significados indicados anteriormente como
preferentes (preferentemente).
- Serán especialmente preferentes según la invención los compuestos de la
- 25 fórmula (I), en los que se presente una combinación de los significados indicados
anteriormente como especialmente preferentes.
- Serán muy especialmente preferentes según la invención los compuestos de la
fórmula (I) en los que se presente una combinación de los significados indicados
anteriormente como muy especialmente preferentes.

Deben señalarse según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que se presente una combinación de los significados indicados anteriormente de manera señalada.

Los restos hidrocarbonados saturados o insaturados tales como alquilo o alquenilo pueden ser —incluso en combinación con heteroátomos, como por ejemplo en alcoxi, de cadena lineal o de cadena ramificada en tanto en cuanto sea posible.

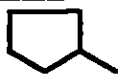
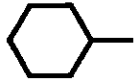
Los restos substituidos en caso dado pueden estar substituidos una o varias veces, en tanto en cuanto no se diga otra cosa, pudiendo ser los substituyentes iguales o diferentes en el caso de polisustituciones.

En particular se citarán, por ejemplo, además de los compuestos indicados en los ejemplos de obtención, los compuestos de la fórmula (I-1-a) siguientes

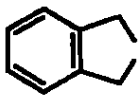


$X = CH_3$, $V^1 = 3-Cl$, $V^2 = H$.

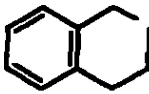
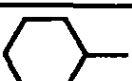
Tabla 1:

A	B	D
CH ₃	H	H
C ₂ H ₅	H	H
C ₃ H ₇	H	H
i-C ₃ H ₇	H	H
C ₄ H ₉	H	H
i-C ₄ H ₉	H	H
s-C ₄ H ₉	H	H
t-C ₄ H ₉	H	H
CH ₃	CH ₃	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₃ H ₇	CH ₃	H
i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	CH ₃	H
	CH ₃	H
	CH ₃	
-(CH ₂) ₂ -		H
-(CH ₂) ₄ -		H
-(CH ₂) ₅ -		H
-(CH ₂) ₆ -		H

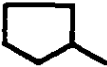
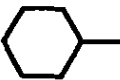
Continuación tabla 1:

A	D	B
	$-(CH_2)_7-$	H
	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	H
	$-CH_2-O-(CH_2)_3-$	H
	$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$	H
	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	H
	$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$	H
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-(CH_2)_2-CH- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad CH_2 \end{array}$	H
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-CH_2- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad (CH_2)_4 \end{array}$	H
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-(CH_2)_2- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad (CH_2)_3 \end{array}$	H
		H

Continuación tabla 1:

A	D	B
		H
	$-(CH_2)_3-$	H
	$-(CH_2)_4-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-CH_2-$	H
	$-CH_2-CH_2-CHCH_3-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-CHCH_3-$	H
	$-CH_2-S-CH_2-$	H
	$-CH_2-S-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-S-CH_2-$	H
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH- \\ \quad \quad \\ (CH_2)_3 \end{array}$	H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	$i-C_3H_7$	H
H		H
H		H
H		H
CH_3	CH_3	H
CH_3	C_2H_5	H
CH_3	C_3H_7	H
CH_3	$i-C_3H_7$	H

Continuación tabla 1:

A	D	B
CH ₃		H
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

- 5

Tabla 2: A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.
- Tabla 3:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = CH₃; V¹ = 3-CF₃; V² = H.
- Tabla 4:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = CH₃; V¹ = 4-CF₃; V² = H.
- 10

Tabla 5: A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = 2-Cl.
- Tabla 6:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = 3-Cl.
- 15

Tabla 7: A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = CH₃; V¹ = 4-CH₃; V² = H.
- Tabla 8:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = CH₃; V¹ = 2-Cl; V² = 6-OCH₃.
- Tabla 9:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = C₂H₅; V¹ = 4-Cl; V² = H.
- 20

Tabla 10: A, B y D como se ha indicado en la tabla 1

X = C₃H₇; V¹ = 4-Cl; V² = H.

- Tabla 11:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = C_2H_5$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = H$.
- Tabla 12:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = C_3H_7$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = H$.
- 5 **Tabla 13:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = C_2H_5$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.
- Tabla 14:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = C_2H_5$; $V^1 = 3-CF_3$; $V^2 = H$.
- Tabla 15:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 10 $X = C_3H_7$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.
- Tabla 16:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = C_3H_7$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.
- Tabla 17:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = Cl$; $V^1 = 4-Cl$; $V^2 = H$.
- 15 **Tabla 18:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = Br$; $V^1 = 4-Cl$; $V^2 = H$.
- Tabla 19:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = C_2H_5$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = 4-Cl$.
- Tabla 20:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 20 $X = C_3H_7$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = 4Cl$.
- Tabla 21:** A, B y D como se ha indicado en la tabla 1
 $X = CH_3$; $V^1 = 4-Br$; $V^2 = H$.

En particular pueden citarse, además de los compuestos citados en los ejemplos de obtención, los compuestos de la fórmula (I-2-a) siguientes:

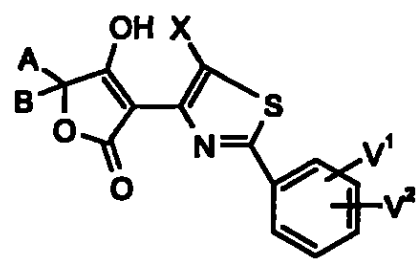
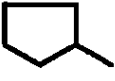
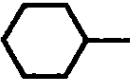


Tabla 22: X = CH₃, V¹ = 3-Cl, V² = H.

A	B
CH ₃	H
C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	H
i-C ₃ H ₇	H
C ₄ H ₉	H
i-C ₄ H ₉	H
s-C ₄ H ₉	H

Continuación tabla 22:

A	B
$t\text{-C}_4\text{H}_9$	H
CH_3	CH_3
C_2H_5	CH_3
C_3H_7	CH_3
$i\text{-C}_3\text{H}_7$	CH_3
C_4H_9	CH_3
$i\text{-C}_4\text{H}_9$	CH_3
$s\text{-C}_4\text{H}_9$	CH_3
$t\text{-C}_4\text{H}_9$	CH_3
	CH_3
	CH_3
	CH_3
$\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-}$	
$\text{-(CH}_2\text{)}_4\text{-}$	
$\text{-(CH}_2\text{)}_5\text{-}$	
$\text{-(CH}_2\text{)}_6\text{-}$	
$\text{-(CH}_2\text{)}_7\text{-}$	
$\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-O-(CH}_2\text{)}_2\text{-}$	
$\text{-CH}_2\text{-O-(CH}_2\text{)}_3\text{-}$	
$\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-S-(CH}_2\text{)}_2\text{-}$	
$\text{-CH}_2\text{-CHCH}_3\text{-(CH}_2\text{)}_3\text{-}$	
$\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-CHCH}_3\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-}$	
$\text{(CH}_2\text{)}_2\text{-CHC}_2\text{H}_5\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-}$	

Continuación tabla 22:

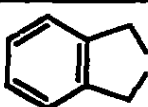
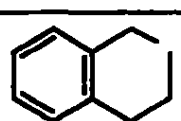
A	B
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-(CH_2)_2-CH- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad CH_2 \end{array}$	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-CH_2- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad (CH_2)_4 \end{array}$	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-(CH_2)_2- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad (CH_2)_3 \end{array}$	
	
	

Tabla 23: A y B como se ha indicado en la tabla 22

X = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.

5 Tabla 24: A y B como se ha indicado en la tabla 22

X = CH₃; V¹ = 3-CF₃; V² = H.

Tabla 25: A y B como se ha indicado en la tabla 22

X = CH₃; V¹ = 4-CF₃; V² = H.

- Tabla 26:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = 2\text{-Cl}$.
- Tabla 27:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = 3\text{-Cl}$.
- 5 **Tabla 28:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-CH}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 29:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{CH}_3$; $V^1 = 2\text{-Cl}$; $V^2 = 6\text{-OCH}_3$.
- Tabla 30:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 10 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 31:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 32:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- 15 **Tabla 33:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 34:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 35:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 20 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 36:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $V^1 = 3\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 37:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{C}_3\text{H}_7$; $V^1 = 3\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.
- 25 **Tabla 38:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{Cl}$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 39:** A y B como se ha indicado en la tabla 22
 $X = \text{Br}$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.
- Tabla 40:** A y B como se ha indicado en la tabla 22

$X = C_2H_5$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = 4-Cl$.

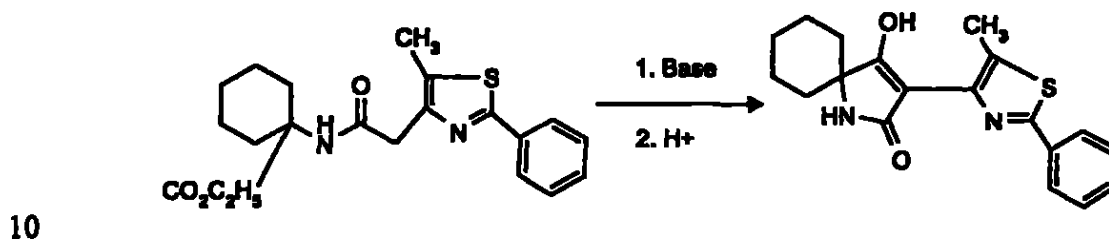
Tabla 41: A y B como se ha indicado en la tabla 22

$X = C_3H_7$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = 4-Cl$.

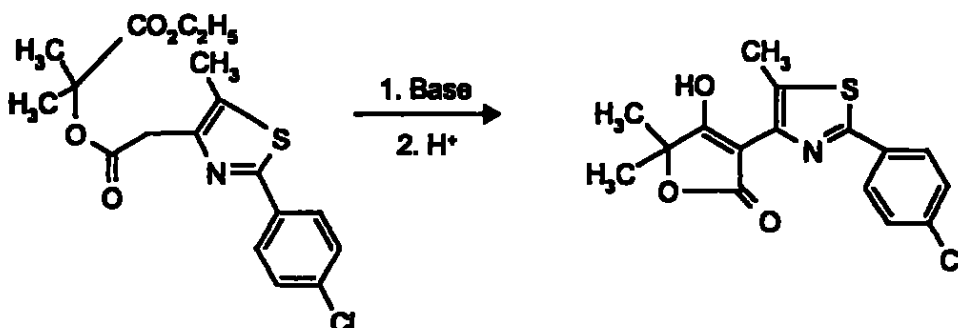
Tabla 42: A y B como se ha indicado en la tabla 22

5 $X = CH_3$; $V^1 = 4-Br$; $V^2 = H$.

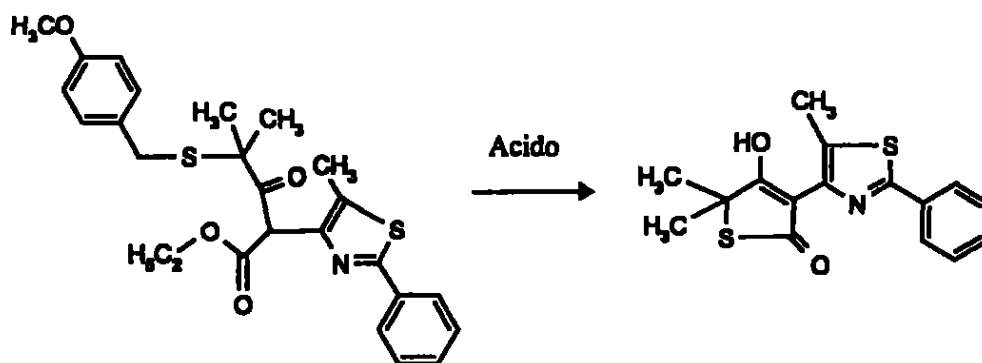
Si se emplea, según el procedimiento (A), el N-[4-(5-metil-2-fenil)-tiazolil-acetil]-1-amino-ciclohexano-carboxilato de etilo como producto de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento según la invención por medio del esquema de reacción siguiente:



Si se emplea, según el procedimiento (B) el O-[4-(5-metil-2-(4-cloro)-fenil)-tiazolilacetil]-2-hidroxiisobutirato de etilo, podrá representarse el desarrollo del procedimiento según la invención por medio del esquema de reacción siguiente:

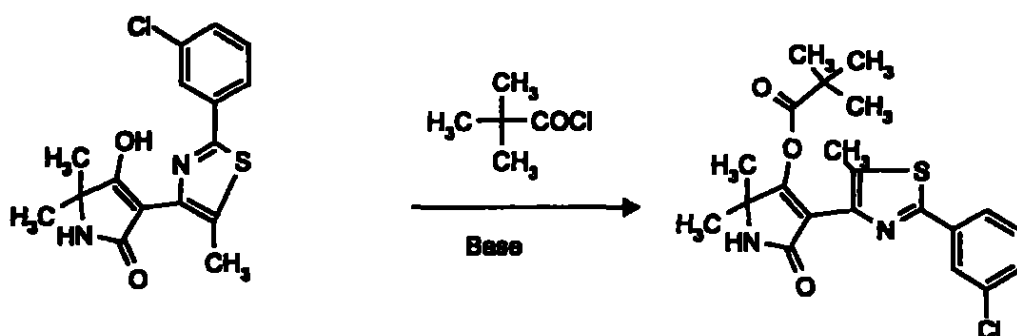


15 Si se emplea, según el procedimiento (C) el 2-[4-(5-metil-2-fenil)-tiazolil]-4-(4-metoxi)-bencilmercapto-4-metil-3-oxo-valerianato de etilo, podrá representarse el desarrollo del procedimiento según la invención por medio del esquema de reacción siguiente:



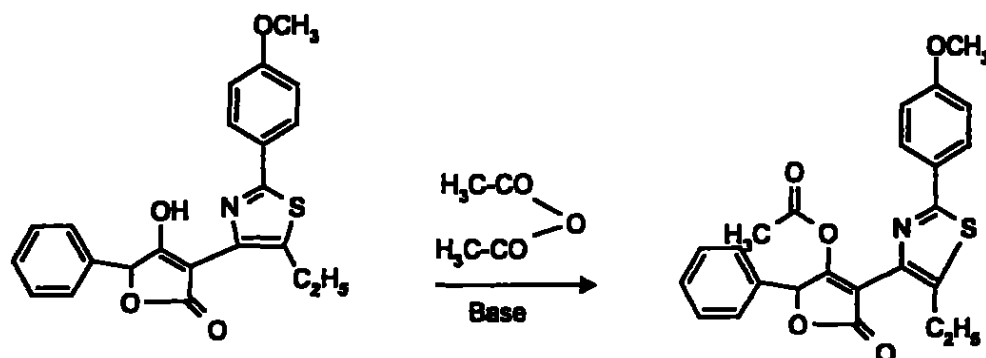
Si se emplean, según el procedimiento (Dα) la 3-[4-(5-metil-2-(3-cloro-fenil)-tiazolil]-5,5-dimetilpirrolidin-2,4-diona y el cloruro de pivaloilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento según la

5 invención por medio del esquema de reacción siguiente:

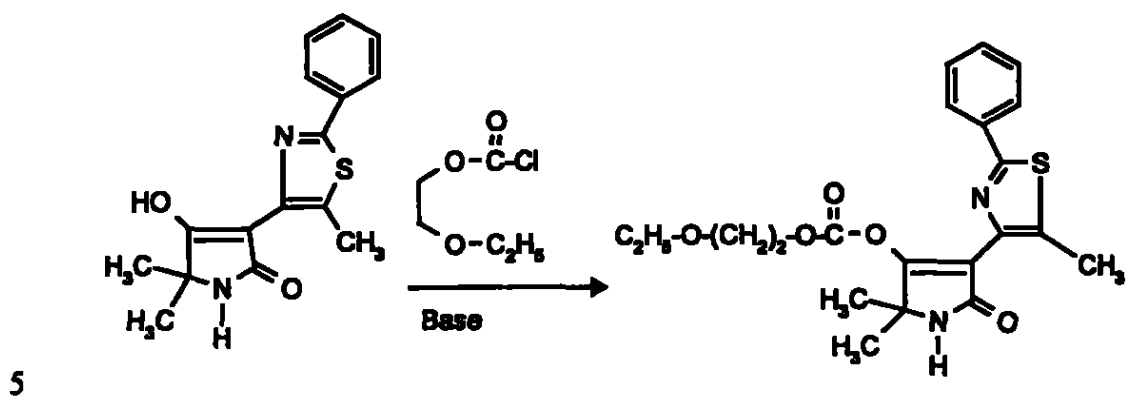


Si se emplean, según el procedimiento (Dβ) la 3-[4-(5-etil-2-(4-metoxi-fenil))-tiazolil]-4-hidroxi-5-fenil-Δ³-dihidrofuran-2-ona y el anhídrido acético como compuestos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento según la

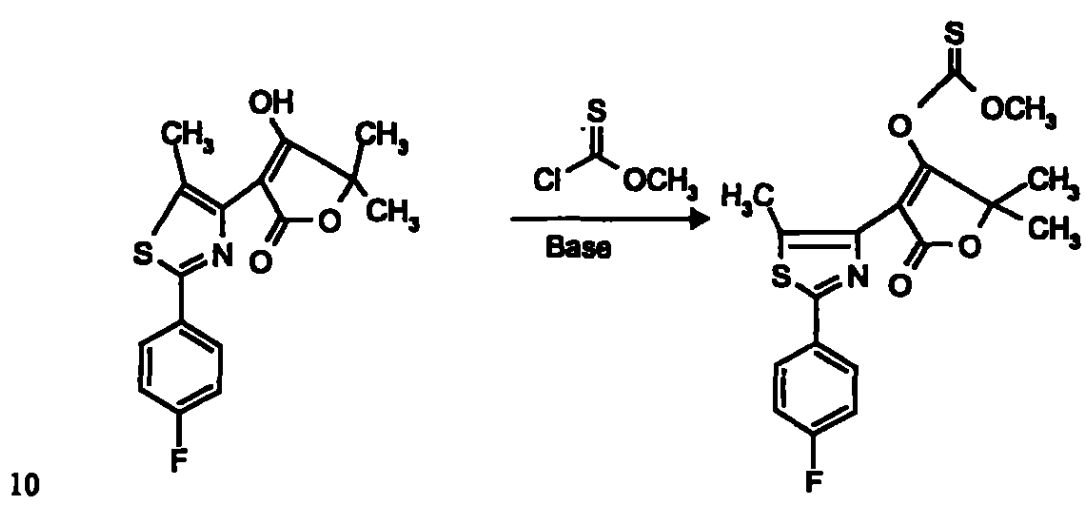
10 invención por medio del esquema de reacción siguiente:



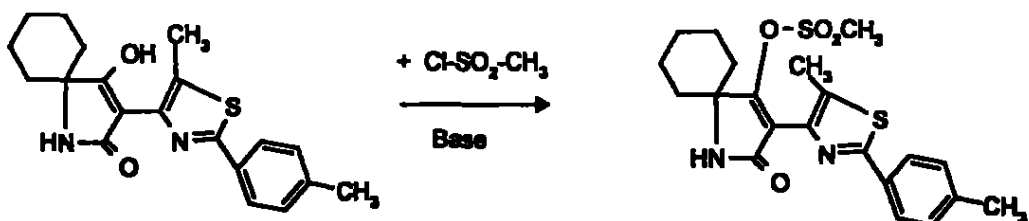
Si se emplean, según el procedimiento (E) la 3-[4-(5-metil-2-fenil)-tiazolil]-5,5-dimetilpirrolidin-2,4-diona y el cloroformiato de etoxietilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento según la invención por medio del esquema de reacción siguiente:



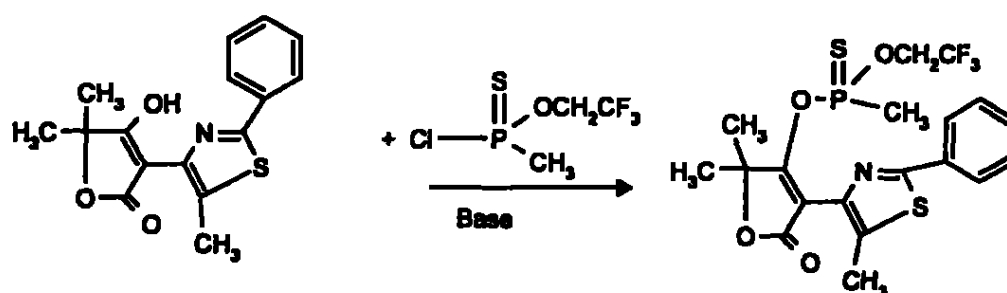
Si se emplean, según el procedimiento (F), la 3-[4-(5-metil-2-(4-flúor-fenil))-tiazolil]-4-hidroxi-5,5-dimetil- Δ^3 -dihidrofuran-2-ona y el cloromonotioformiato de metilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo de la reacción de la manera siguiente:



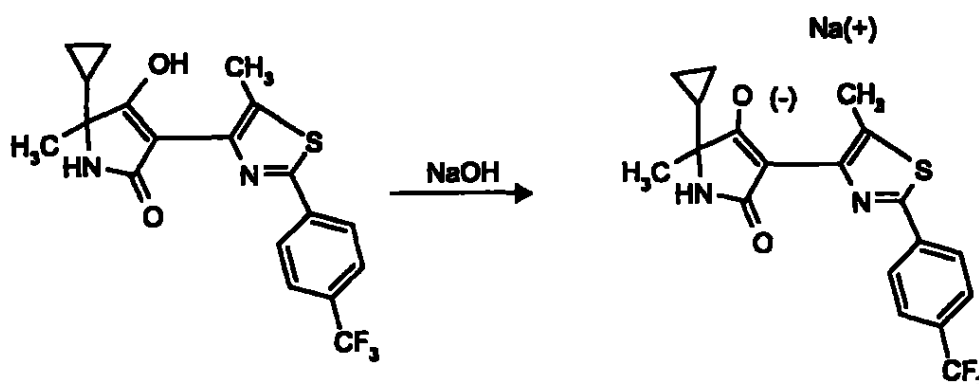
Si se emplean, según el procedimiento (G), la 3-[4-(5-metil-3-(4-metil-fenil))-tiazolil]-5,5-pentametilen-pirrolidin-2,4-diona y el cloruro de metanosul-fonilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo de la reacción por medio del esquema de reacción siguiente:



Si se emplean, según el procedimiento (H), la 3-[4-(5-metil-2-fenil)-tiazolil]-4-hidroxi-5,5-dimetil- Δ^3 -dihidrofuran-2-ona y el cloruro de metanotio-fosfonilo (2,2,2-trifluoretiléster) como productos de partida, podrá representarse el desarrollo de la reacción por medio del esquema de reacción siguiente:

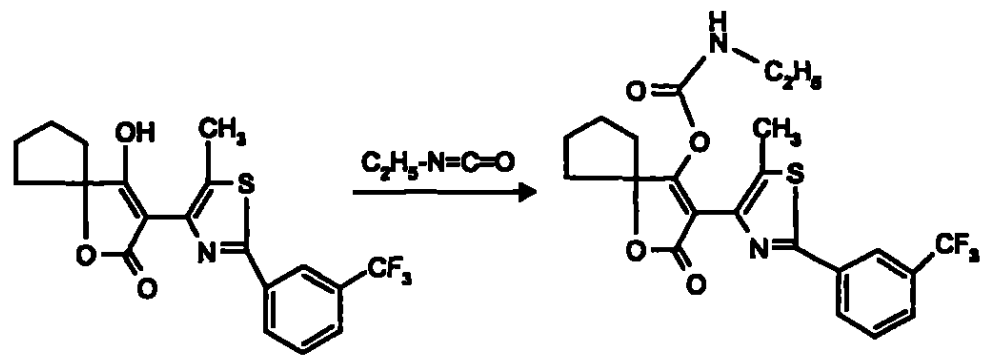


Si se emplean, según el procedimiento (I), la 3-[4-(5-metil-2-(4-trifluorme-til-fenil))-tiazolil]-5-ciclopropil-5-metil-pirrolidin-2,4-diona y NaOH como componentes, podrá representarse el desarrollo del procedimiento según la invención por medio del esquema de reacción siguiente:

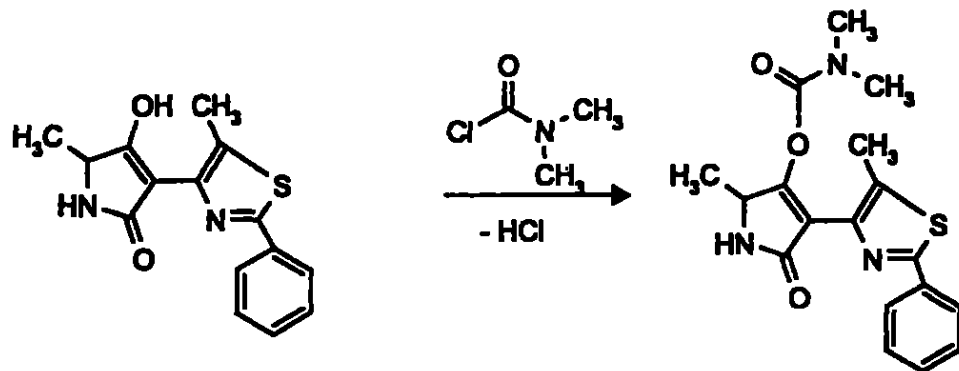


Si se emplean, según el procedimiento (Jα) la 3-[4-(5-metil-2-(3-trifluorme-til-fenil))-tiazolil]-4-hidroxi-5-tetrametilen- Δ^3 -dihidro-furan-2-ona y el isocianato de

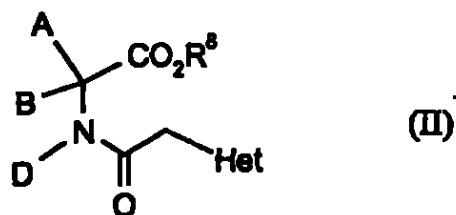
etilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo de la reacción por medio del esquema de reacción siguiente:



Si se emplean, según el procedimiento (J β), la 3-[4-(5-metil-2-fenil)-tiazolil]-5-metil-pirrolidin-2,4-diona y el cloruro de dimetilcarbamidilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo de la reacción por medio del esquema siguiente:



Los compuestos de la fórmula (II)



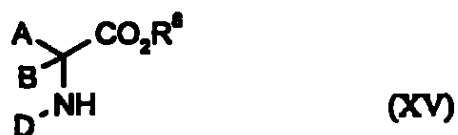
10

en la que

A, B, D, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados, necesarios como productos de partida para el procedimiento (a) según la invención,

son nuevos.

Se obtienen los ésteres del acilaminoácidos de la fórmula (II) por ejemplo si se acilan derivados de aminoácidos de la fórmula (XV)



5 en la que

A, B, R⁸ y D tienen los significados anteriormente indicados,
con derivados de ácidos hetarilacéticos substituidos de la fórmula (XVI)



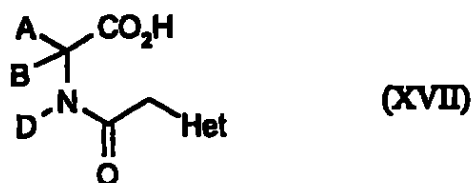
en la que

10 Het tiene el significado anteriormente indicado y

W significa un grupo disociable introducido mediante reactivos para la activación de ácidos carboxílicos tales como carbonildiimidazol, carbonildiimididas (tal como por ejemplo dicitclohexilcarbodiimida), reactivos de fosforilado (tales como por ejemplo POCl₃, BOP-Cl), agentes de halogenación, por ejemplo cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo, fosgeno o ésteres del ácido clorofórmico (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J.Chem. 6, 341-5, 1968)

15

o si se esterifican acilaminoácidos de la fórmula (XVII)

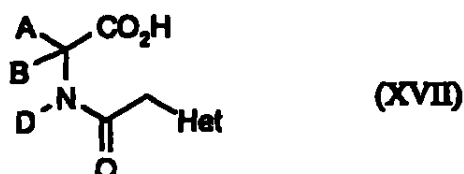


en la que

A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados,

(Chem. Ind. (London) 1568 (1968)).

Los compuestos de la fórmula (XVII)



S

en la que

A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados,

son nuevos.

Se obtienen los compuestos de la fórmula (XVII), si se acilan, por ejemplo
10 según Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften,
Berlín 1977, página 505), aminoácidos de la fórmula (XVIII)



en la que

A, B y D tienen los significados anteriormente indicados,

15 con derivados de ácidos hetarilacéticos sustituidos de la fórmula (XVI)



en la que

W y Het tienen los significados anteriormente indicados.

Los compuestos de la fórmula (XVI) son parcialmente nuevos. Estos pueden
20 obtenerse según procedimientos conocidos en principio (véase por ejemplo H.

Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, tomo 8, páginas 467-469 (1952)).

Se obtienen los compuestos de la fórmula (XVI) por ejemplo si se hacen reaccionar ácidos hetarilacéticos substituidos de la fórmula (XIX)



5

en la que

X e Y tienen el significado anteriormente indicado,

con agentes de Halogenación (por ejemplo cloruro de tionilo, bromuro de tionilo, cloruro de oxalilo, fosgeno, tricloruro de fósforo, tribromuro de fósforo y
 10 pentacloruro de fósforo) en caso dado en presencia de un diluyente (por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos en caso dado clorados tales como tolueno o cloruro de metileno) a temperaturas desde -20°C hasta 150°C, preferentemente desde -10°C hasta 100°C.

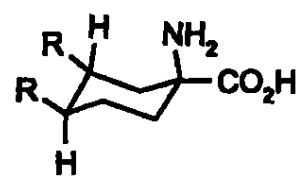
Los ácidos hetarilacéticos de la fórmula (XIX) son parcialmente adquiribles
 15 en el comercio, parcialmente son nuevos o pueden prepararse según procedimientos conocidos en principio

- a) ácidos tiazolilacéticos: C.S. Rooney et al. J. Med. Chem. 26, 700-714 (1983); EP-A-368 592; M.S. Malamas et al. J. Med. Chem. 39, 237-246 (1996); J. L. Collins et al. J. Med. Chem. 41, 5037-5054 (1998); NL-A-66 14 130;
- 20 b) ácidos oxazolilacéticos: K. Meguro et al., Chem. Pharm. Bull, 34, 2840-2851 (1986), M. Sehi et al., Chem. Pharm. Bull. 36, 4435-4440 (1988), Malmas et al., J. Med. Chem. 39, 237-245 (1996), EP 0 177 353 A2, WO 87/03 807, WO 95/18 125, B. Hulin, J. Med. Chem. 35, 1853-1864 (1992), EP 0 389 699 A 1.

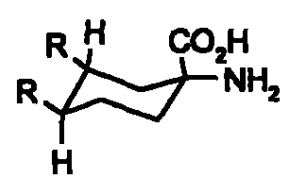
25 Los compuestos de las fórmulas (XV) y (XVIII) son parcialmente adquiribles en el comercio y/o conocidos y/o pueden obtenerse según procedimientos conocidos

(véase por ejemplo Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14] 5, páginas 11-22, 23-27 (1970)).

Los ácidos aminocarboxílicos cíclicos substituidos de la fórmula (XVIIIa), en la que A y B forman un anillo, pueden obtenerse, en general, según la síntesis de Bucherer-Bergs o según la síntesis de Strecker y en este caso se obtienen respectivamente en diversas formas isómeras. De este modo bajo las condiciones de la síntesis de Bucherer-Bergs se obtienen preponderantemente los isómeros (designados a continuación como β con objeto de simplificar), en los cuales el resto R y el grupo carboxilo se encuentran en posición ecuatorial, mientras que según las condiciones de Strecker se obtienen preponderantemente los isómeros (designados a continuación como α con objeto de simplificar, en los cuales el grupo amino y el resto R se encuentran en posición ecuatorial



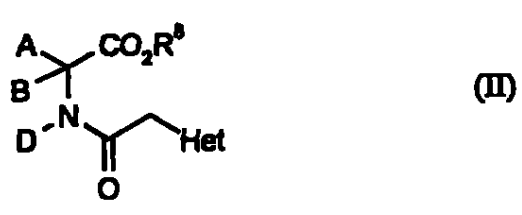
Síntesis de Bucherer-Bergs
(isómero β)



Síntesis de Strecker
(isómero α)

(L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J.T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975).

Además pueden prepararse los compuestos de partida, empleados en el procedimiento (A) anterior de la fórmula (II)



en la que
A, B, D, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados,

si se hacen reaccionar aminonitrilos de la fórmula (XX)



en la que

A, B y D tienen los significados anteriormente indicados,

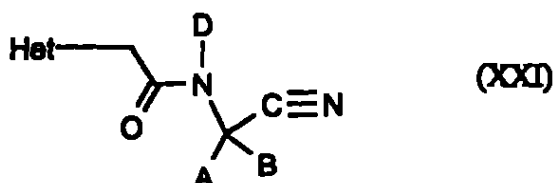
5 con derivados de ácidos hetarilacéticos substituidos de la fórmula (XVI)



en la que

W y Het tienen los significados anteriormente indicados,

para dar compuestos de la fórmula (XXI)



10

en la que

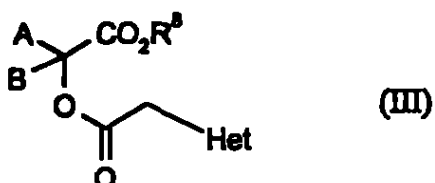
A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados,

y éstos se someten a continuación a una alcoholisis ácida.

Los compuestos de la fórmula (XXI) son igualmente nuevos.

15

Los compuestos, necesarios como productos de partida en el procedimiento (B) según la invención, de la fórmula (III)



en la que

A, B, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados,
son nuevos.

Pueden obtenerse según métodos conocidos en principio.

- 5 De este modo se obtienen los compuestos de la fórmula (III) por ejemplo si se acilan ésteres de ácidos 2-hidroxicarboxílicos de la fórmula (XXII)



en la que

A, B y R^8 tienen los significados anteriormente indicados,

- 10 con derivados de ácidos hetarilacéticos substituidos de la fórmula (XVI)



en la que

W y Het tienen los significados anteriormente indicados,

(Chem. Reviews 52, 237-416 (1953).

- 15 Además se obtienen los compuestos de la fórmula (III), si se alquilan ácidos hetarilacéticos substituidos de la fórmula (XIX)



en la que

Het tienen los significados anteriormente indicados,

- 20 con ésteres de ácidos α -halógenocarboxílicos de la fórmula (XXIII)

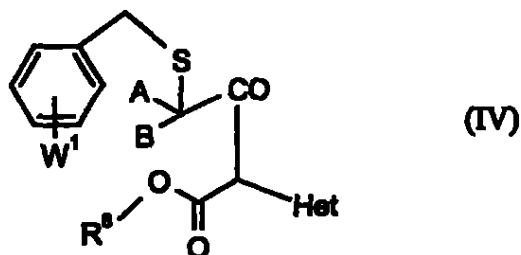


en la que

A, B y R^8 tienen los significados anteriormente indicados y

Hal significa cloro o bromo.

- 5 Los compuestos, necesarios como productos de partida en el procedimiento (C) anterior, de la fórmula (IV)



en la que

A, B, W^1 , Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados y

- 10 W^1 significa hidrógeno, halógeno, alquilo (preferentemente alquilo con 1 a 6 átomos de carbono) o alcoxi (preferentemente alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono),

son nuevos.

Estos pueden obtenerse según procedimientos conocidos en principio.

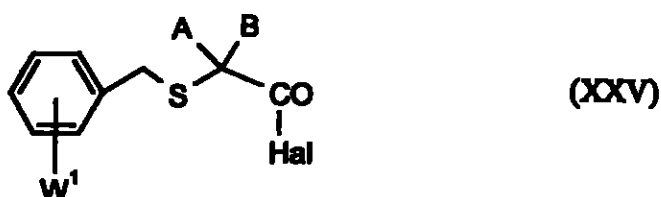
- 15 Se obtienen los compuestos de la fórmula (IV) por ejemplo, si se acilan compuestos de la fórmula (XXIV)



en la que

Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados,

con halogenuros de 2-benciltio-carbonilo de la fórmula (XXV)



en la que

A, B y W¹ tienen los significados anteriormente indicados y

5 Hal significa halógeno (especialmente cloro o bromo),

en presencia de bases fuertes (véase por ejemplo M.S. Chambers, E.J. Thomas, D.J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228).

Los compuestos de la fórmula (XXIV) pueden adquirirse parcialmente en el comercio, en parte son conocidos o pueden prepararse según procedimientos en sí
10 conocidos:

- a) Esteres del ácido tiazolilacético: C.S. Rooney et al., J. Med. Chem. 26, 700-714 (1983), EP-A-368 592), M.S. Malmas et al., J. Med. Chem. 39, 237-246 (1996); J. C. Collins et al., J. Med. Chem. 41, 5037-5054 (1998); NL-A-6 614 130.
- 15 b) Acidos oxazolilacéticos: K. Meguro et al., Chem. Pharm. Bull, 34, 2840-2851 (1986), M. Sehi et al., Chem. Pharm. Bull. 36, 4435-4440 (1988), Malmas et al., J. Med. Chem. 39, 237-245 (1996), EP 0 177 353 A2, WO 87/03 807, WO 95/18 125, Hulin, J. Med. Chem. 35, 1853-1864 (1992), EP 0 389 699 A 1.

20 Los halogenuros de acilo de la fórmula (V), los anhídridos de los ácidos carboxílicos de la fórmula (VI), los ésteres del ácido clorofórmico o los tioésteres del ácido clorofórmico de la fórmula (VII), los ésteres del ácido cloromonotiofórmico o los ésteres del ácido cloroditiofórmico de la fórmula (VIII), los cloruros de sulfonilo de la fórmula (IX), los compuestos del fósforo de la fórmula (X) y los hidróxidos de
25 metales alcalinos, los óxidos de metales alcalinos o las aminas de la fórmula (XI) y

(XII) y los isocianatos de la fórmula (XIII) y los cloruros de carbamidilo de la fórmula (XIV), necesarios para la realización de los procedimientos según la invención (D), (E), (F), (G), (H), (I) y (J), son compuestos conocidos en general de la química orgánica o bien de la química inorgánica.

- 5 Los compuestos de las fórmulas (XV), (XVIII), (XX), (XXII), (XXIII) y (XXV), son en parte adquiribles en el comercio, en partes son conocidos y/o pueden prepararse según métodos conocidos en principio.

El procedimiento (A) se caracteriza porque se someten a una condensación intramolecular los compuestos de la fórmula (II), en la que A, B, D, Het y R⁸ tienen
10 los significados anteriormente indicados, en presencia de una base.

Como diluyentes en la realización del procedimiento (A) pueden emplearse todos los disolventes orgánicos inertes. Preferentemente pueden emplearse hidrocarburos, tales como tolueno y xileno, además éteres, tales como dibutiléter, tetrahydrofurano, dioxano, glicoldimetiléter y diglicoldimetiléter, además disolventes
15 polares, tales como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida y N-metilpirrolidona, así como alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, iso-propanol, butanol, iso-butanol o terc.-butanol.

Como bases (agentes de desprotonizado) pueden emplearse en la realización del procedimiento (A) según la invención todos los aceptores de protones usuales.
20 Preferentemente pueden emplearse óxidos, hidróxidos y carbonatos de metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, óxido de magnesio, óxido de calcio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de calcio, que pueden emplearse también en presencia de catalizadores de transferencia de fases tales como por ejemplo cloruro de trietilben-
25 cilamonio, bromuro de tetrabutylamonio, Adogen 464 (= cloruro de metiltrialquil (con 8 a 10 átomos de carbono)amonio) o TDA 1 (= tris-(metoxietoxietil)-amina). Además pueden emplearse metales alcalinos tales como sodio o potasio. Además pueden emplearse amidas e hidruros de metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como amida de sodio, hidruro de sodio e hidruro de calcio, y

además también alcoholatos de metales alcalinos, tales como metilato de sodio, etilato de sodio y terc.-butilato de potasio.

En la realización del procedimiento (A) según la invención las temperaturas de la reacción pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a
5 temperaturas comprendidas entre -80°C y 180°C , preferentemente entre -50°C y 120°C .

El procedimiento (A) según la invención se lleva a cabo, en general, bajo presión normal.

En la realización del procedimiento (A) según la invención se emplean los
10 componentes de la reacción de la fórmula (II) y las bases desprotonizadoras, en general, en una cantidad dos veces equimolar aproximadamente. Sin embargo es posible también emplear uno u otro de los componentes con un exceso mayor (de hasta 3 moles).

El procedimiento (B) se caracteriza porque se someten a una condensación
15 intramolecular los compuestos de la fórmula (III), en la que A, B, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados, en presencia de un diluyente y en presencia de una base.

Como diluyentes pueden emplearse en el procedimiento (B) según la invención todos los disolventes orgánicos inertes. Preferentemente pueden emplearse
20 hidrocarburos, tales como tolueno y xileno, además éteres, tales como dibutiléter, tetrahidrofurano, dioxano, glicoldimetiléter y diglicoldimetiléter, además disolventes polares tales como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida y N-metilpirrolidona. Además pueden emplearse alcoholes tales como metanol, propanol, iso-propanol, butanol, iso-butanol y terc.-butanol.

25 Como bases (agentes de desprotonizado) pueden emplearse, en la realización del procedimiento (B) según la invención, todos los aceptores de protones usuales. Preferentemente pueden emplearse óxidos, hidróxidos y carbonatos de metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, óxido de magnesio, óxido de calcio, carbonato de sodio, carbonato de

potasio y carbonato de calcio, que se pueden emplear también en presencia de catalizadores de transferencia de fases tales como por ejemplo cloruro de trietilbencilamonio, bromuro de tetrabutylamonio, Adogen 464 (= cloruro de metiltrialquil (con 8 a 10 átomos de carbono)amonio) o TDA 1 (= tris-
5 (metoxietoxietil)-amina). Además pueden emplearse metales alcalinos tales como sodio o potasio. Además pueden emplearse amidas e hidruros de metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como amida de sodio, hidruro de sodio e hidruro de calcio, y además también alcoholatos de metales alcalinos tales como metilato de sodio, etilato de sodio y terc.-butilato de potasio.

10 En la realización del procedimiento (B) según la invención las temperaturas de la reacción pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre -80°C y 180°C , preferentemente entre -50°C y 120°C .

El procedimiento (B) según la invención se lleva a cabo en general bajo
15 presión normal.

En la realización del procedimiento (B) según la invención se emplean los componentes de la reacción de la fórmula (III) y las bases desprotonizadoras, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. No obstante es posible también emplear uno u otro de los componentes en un exceso mayor (de hasta 3
20 moles).

El procedimiento (C) se caracteriza porque se ciclan intramolecularmente compuestos de la fórmula (IV) en la que A, B, Het y R^8 tienen el significado anteriormente indicado, en presencia de un ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

25 Como diluyentes pueden emplearse en el procedimiento (C) según la invención todos los disolventes orgánicos inertes. Preferentemente pueden emplearse hidrocarburos, tales como tolueno y xileno, además hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, cloruro de etileno, clorobenceno, diclorobenceno, además disolventes polares, tales como dimetilsulfóxido, sulfolano,

dimetilformamida y N-metil-pirrolidona. Además pueden emplearse alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, iso-propanol, butanol, isobutanol, terc.-butanol.

En caso dado puede servir como diluyente también el ácido empleado.

Como ácidos pueden emplearse en el procedimiento (C) según la invención
5 todos los ácidos inorgánicos y orgánicos usuales tales como por ejemplo ácidos hidrácidos halogenados, ácido sulfúrico, ácidos alquil-, aril- y halógenoalquilsulfónicos, especialmente ácidos alquilcarboxílicos halogenados tal como por ejemplo ácido trifluoracético.

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (C) según
10 la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre -30°C y 250°C, preferentemente entre 0°C y 150°C.

El procedimiento (C) según la invención se lleva a cabo en general bajo presión normal. E

En la realización del procedimiento (C) según la invención se emplean los
15 componentes de la reacción de la fórmula (IV) y los ácidos por ejemplo en cantidades equimolares. No obstante es posible también emplear el ácido a modo de disolvente o a modo de catalizador.

El procedimiento (D-α) se caracteriza por que se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) respectivamente con
20 halogenuros de carbonilo de la fórmula (V) en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido.

Como diluyentes pueden emplearse en el procedimiento (D-α) según la invención todos los disolventes inertes frente a los halogenuros de acilo. Preferentemente pueden emplearse hidrocarburos, tales como bencina, benceno, tolueno, xileno y tetralina, además hidrocarburos halogenados, tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno y o-diclorobenceno, además cetonas, tales como acetona y metilisopropilcetona, además éteres, tales como dietiléter, tetrahidrofurano y dioxano, además ésteres de ácidos carboxílicos,

25

tal como acetato de etilo, nitrilos, tal como acetonitrilo y también disolventes polares fuertes, tales como dimetilformamida, dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y sulfolano. Cuando lo permita la estabilidad a la hidrólisis del halogenuro de acilo puede llevarse a cabo la reacción también en presencia de agua.

- 5 Como agentes aceptores de ácido en la reacción del procedimiento (D α) según la invención entran en consideración todos los aceptores de ácido usuales. Preferentemente pueden emplearse aminas terciarias, tales como trietilamina, piridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicycloundeceno (DBU), diazabicyclononeno (DBN), bases de Hünig y N,N-dimetil-anilina, además óxidos de
- 10 metales alcalinotérreos, tales como óxido de magnesio y de calcio, además carbonato de metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de calcio así como hidróxidos alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio.

- Las temperaturas de la reacción en el procedimiento (D- α) según la invención
- 15 pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre -20°C y +150°C, preferentemente entre 0°C y 100°C.

- En la realización del procedimiento (D- α) según la invención se emplean los productos de partida de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) y el halogenuro de carbonilo de la fórmula (V), en general, en cantidades aproximadamente
- 20 equivalentes. No obstante es posible también emplear el halogenuro de carbonilo en un exceso mayor (de hasta 5 moles). La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales.

- El procedimiento (D- β) se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) con anhídridos de ácidos carboxílicos de la
- 25 fórmula (VI) en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido.

 Como diluyentes pueden emplearse en el procedimiento (D- β) según la invención preferentemente aquellos diluyentes que entran en consideración también

en el caso del empleo de los halogenuros de acilo. Por lo demás también puede actuar como diluyente un exceso del anhídrido del ácido carboxílico empleado.

Como agentes aceptores de ácido, añadidos en caso dado, entran en consideración, en el caso del procedimiento (D-β), preferentemente aquellos
5 diluyentes que entran en consideración también preferentemente en el caso del empleo de los halogenuros de acilo.

Las temperaturas de la reacción en el procedimiento (D-β) según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre -20°C y +150°C, preferentemente entre 0°C y 100°C.

10 En la realización del procedimiento (D-β) según la invención se emplean los productos de partida de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) y el anhídrido del ácido carboxílico de la fórmula (VI) en general en cantidades aproximadamente equivalentes. No obstante es posible también emplear el anhídrido del ácido carboxílico en un exceso mayor (de hasta 5 moles). La elaboración se lleva a cabo
15 según métodos usuales.

En general se procede de tal manera que se eliminan el diluyente y el anhídrido del ácido carboxílico, presente en exceso, así como el ácido carboxílico formado, mediante destilación o mediante lavado con un disolvente orgánico o con agua.

20 El procedimiento (E) se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) respectivamente con ésteres del ácido clorofórmico o con tiolésteres del ácido clorofórmico de la fórmula (VII) en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido.

25 Como agentes aceptores de ácido entran en consideración en el caso de la reacción según el procedimiento (E) de la invención, todos los aceptores de ácido usuales. Preferentemente pueden emplearse aminas terciarias, tales como trietilamina, piridina, DABCO, DBU, DBA, bases de Hünig y N,N-dimetil-anilina,

además óxidos de metales alcalinotérreos, tales como óxido de magnesio y óxido de calcio, además carbonatos de metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de calcio, así como hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio.

Como diluyentes pueden emplearse en el procedimiento (E) según la invención todos los disolventes inertes frente a los ésteres del ácido clorofórmico o bien frente a los tiolésteres del ácido clorofórmico. Preferentemente pueden emplearse hidrocarburos, tales como bencina, benceno, tolueno, xileno y tetralina, además hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno y o-diclorobenceno, además cetonas, tales como acetona y metilisopropilcetona, además éteres, tales como dietiléter, tetrahidrofurano y dioxano, además ésteres de ácidos carboxílicos, tal como acetato de etilo, nitrilos tal como acetonitrilo y también disolventes polares fuertes, tales como dimetilformamida, dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y sulfolano.

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (E) según la invención pueden variar dentro de amplios límites. Si se trabaja en presencia de un diluyente y de un agente aceptor de ácido, las temperaturas de la reacción se encontrarán comprendidas en general entre -20°C y $+100^{\circ}\text{C}$, preferentemente entre 0°C y 50°C .

El procedimiento (E) según la invención se lleva a cabo en general bajo presión normal.

En la realización del procedimiento (E) según la invención se emplean los productos de partida de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) y el correspondiente éster del ácido clorofórmico o bien tioléster del ácido clorofórmico de la fórmula (VII), en general, respectivamente en cantidades aproximadamente equivalentes. No obstante es posible también emplear uno u otro de los componentes en un exceso mayor (de hasta 2 moles). La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que se eliminan las sales precipitadas y la mezcla de

la reacción remanente se concentra por evaporación por eliminación del diluyente.

El procedimiento (F) según la invención se caracteriza porque se hacen reaccionar los compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) respectivamente con los compuestos de la fórmula VIII) en presencia de un diluyente y, en caso dado,
5 en presencia de un agente aceptor de ácido.

En el caso del procedimiento de obtención (F) se hace reaccionar, por mol del compuesto de partida de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) aproximadamente 1 mol de éster del ácido cloromonotiofórmico o bien de éster del ácido cloroditiofórmico de la fórmula (VIII) a 0 hasta 120°C, preferentemente a 20 hasta
10 60°C.

Como diluyentes, añadidos en caso dado, entran en consideración todos los disolventes orgánicos polares inertes, tales como nitrilos, ésteres, éteres, amidas, sulfonas, sulfóxidos, así como también halógenoalcanos.

Preferentemente se emplearán acetonitrilo, acetato de etilo, dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida y cloruro de metileno.
15

Si se prepara la sal de enolato de los compuestos (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a), en una forma preferente de realización, mediante adición de agentes de desprotonizado fuertes tales como por ejemplo hidruro de sodio o butilato terciario de potasio, podrá desistirse a la adición ulterior de agentes aceptores de ácido.

Cuando se utilicen agentes aceptores de ácido entrarán en consideración las bases inorgánicas u orgánicas usuales, por ejemplo pueden indicarse hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, piridina, trietilamina.
20

La reacción puede llevarse a cabo a presión normal o a presión mas elevada, preferentemente se trabajará a presión normal. La elaboración se lleva a cabo según
25 métodos usuales.

El procedimiento (G) según la invención se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) respectivamente con cloruros de sulfonilo de la fórmula (IX) en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido.

En el procedimiento de obtención (G) se hace reaccionar por mol del compuesto de partida de las fórmula (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) aproximadamente 1 mol de cloruro de sulfonilo de la fórmula (IX) a -20 hasta 150°C , preferentemente a 20 hasta 70°C .

- 5 Como diluyentes, añadidos en caso dado, entran en consideración todos los disolventes orgánicos polares inertes, tales como nitrilos, ésteres, éteres, amidas, sulfonas, sulfóxidos o hidrocarburos halogenados tal como cloruro de metileno.

Preferentemente se emplearán acetonitrilo, acetato de etilo, dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida, cloruro de metileno.

- 10 Si se prepara la sal de enolato de los compuestos (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) en una forma preferente de realización, mediante la adición de agentes de desprotonizado fuertes, (tales como por ejemplo hidruro de sodio y butilato terciario de potasio), podrá desistirse a la adición ulterior de agentes aceptores de ácido.

- 15 Cuando se utilicen agentes aceptores de ácido, entrarán en consideración las bases inorgánicas u orgánicas usuales, de manera ejemplificativa pueden citarse hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, piridina, trietilamina.

La reacción puede llevarse a cabo a presión normal o a presión más elevada, preferentemente se trabajará a presión normal. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales.

- 20 El procedimiento (H) según la invención se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) respectivamente con compuestos del fósforo de la fórmula (X) en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido.

- 25 En el procedimiento (H) se hacen reaccionar, para la obtención de los compuestos de las fórmulas (I-1-A-e) hasta (I-3-B-e), sobre 1 mol de los compuestos (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a), de 1 hasta 2, preferentemente de 1 hasta 1,3 moles de compuesto del fósforo de la fórmula (X) a temperaturas comprendidas entre -40°C y 150°C , preferentemente entre -10 y 110°C .

Como diluyentes añadidos en caso dado entran en consideración todos los

disolventes orgánicos polares inertes, tales como éteres, amidas, nitrilos, alcoholes, sulfuros, sulfonas, sulfóxidos, etc.

Preferentemente se emplearán acetonitrilo, dimetilsulfóxido, tetrahydrofurano, dimetilformamida, cloruro de metileno.

- 5 Como agentes aceptores de ácido, añadidos en caso dado, entran en consideración las bases inorgánicas u orgánicas usuales tales como hidróxidos, carbonatos o amidas. De manera ejemplificativa pueden citarse hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, piridina, trietilamina.

- 10 La reacción puede llevarse a cabo bajo presión normal o a presión mas elevada, preferentemente se trabajará a presión normal. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales de la química orgánica. La purificación de los productos finales obtenidos se lleva a cabo preferentemente mediante cristalización, mediante purificación por cromatografía o mediante la denominada "destilación inicial", es decir eliminación de los componentes volátiles en vacío.

- 15 El procedimiento (I) se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) con hidróxidos metálicos o bien con alcóxidos metálicos de la fórmula (XI) o con aminas de la fórmula (XII), en caso dado en presencia de un diluyente.

- 20 En el procedimiento (I) según la invención pueden emplearse como diluyentes preferentemente éteres, tales como tetrahydrofurano, dioxano, dietiléter, o alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol, así como también agua.

El procedimiento (I) según la invención se lleva a cabo en general bajo presión normal.

- 25 Las temperaturas de la reacción se encuentran comprendidas en general entre -20°C y 100°C, preferentemente entre 0°C y 50°C.

El procedimiento (J) según la invención se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a), respectivamente (J- α), con compuestos de la fórmula (XIII) en caso dado en presencia de un diluyente y,

en caso dado, en presencia de un catalizador o (J- β) con compuestos de la fórmula (XIV) en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido.

En el procedimiento de obtención (J α) se hace reaccionar, por mol del
5 compuesto de partida de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) aproximadamente 1 mol de isocianato de la fórmula (XIII) a 0 hasta 100°C, preferentemente a 20 hasta 50°C.

Como diluyentes, añadidos en caso dado, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes, tales como éteres, amidas, nitrilos, sulfonas,
10 sulfóxidos.

En caso dado pueden añadirse catalizadores para acelerar la reacción. Como catalizadores pueden emplearse de una manera muy ventajosa compuestos orgánicos del estaño, tal como por ejemplo dilaurato de dibutilestaño. Preferentemente se trabajará a presión normal.

15 En el procedimiento de obtención (J- β) se hace reaccionar, por mol del compuesto de partida de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a), aproximadamente 1 mol de cloruro de carbamidilo de la fórmula (XIV) a -20 hasta 150°C, preferentemente a 0 hasta 70°C.

Como diluyentes, añadidos en caso dado, entran en consideración todos los
20 disolventes orgánicos polares inertes tales como nitrilos, ésteres, éteres, amidas, sulfonas, sulfóxidos o hidrocarburos halogenados.

Preferentemente se emplearán acetonitrilo, acetato de etilo, dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida o cloruro de metileno.

Si se prepara la sal de enolato de los compuestos (I-1-A-a) hasta (I-3-B-a) en
25 una forma preferente de realización, mediante la adición de agentes de desprotonizado fuertes (tales como por ejemplo hidruro de sodio o butilato terciario de potasio), podrá desistirse a la adición ulterior de agentes aceptores de ácido.

Cuando se utilicen agentes aceptores de ácido entrarán en consideración las

bases inorgánicas u orgánicas usuales, pudiéndose citar de manera ejemplificativa hidróxido de sodio, carbonato de potasio, trietilamina o piridina.

La reacción puede llevarse a cabo a presión normal o bajo presión mas elevada, preferentemente se trabajará a presión normal. La elaboración se lleva a
5 cabo según métodos usuales.

Los productos activos son adecuados, con una buena compatibilidad para con las plantas y una toxicidad favorable para los animales de sangre caliente, para la lucha contra las plagas animales, especialmente insectos, arácnidos y nematodos, que se presentan en agricultura, en selvicultura, para la protección de productos almacenados y
10 de materiales así como en el sector de la higiene. Pueden emplearse, preferentemente, como agentes fitoprotectores. Son activos frente a especies normalmente sensibles y resistentes así como contra todos o algunos de los estadios del desarrollo. A las plagas anteriormente citadas pertenecen:

Del orden de los isópodos por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*,
15 *Porcellio scaber*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus carpophagus*, *Scutigera*
spp..

Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera immaculata*.

20 Del orden de los tisánuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus asseus*.

Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domestica*, *Gryllotalpa* spp.,
Locusta migratoria migratorioides, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

Del orden de los blatáridos, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*,
25 *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*,

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes* spp..

Del orden de los fitiraptos, por ejemplo *Pediculus humanus corporis*,
Haematopinus spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp..

Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Fankliniella accidentalis*.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp..

- 5 Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigenum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*,
10 *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodephax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp..

- Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp.,
15 *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura*
20 *fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.

- Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp.,
25 *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psylloides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp.,

Conoderus spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*, *Lissorhoptrus oryzophilus*..

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp..

- 5 Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*,
10 *Tipula paludosa*, *Hylemyia* spp., *Liriomyza* spp..

Del orden de los sifonópteros, por ejemplo, *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..

- Del orden de los arácnidos, por ejemplo, *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*, *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophys ribis*,
15 *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hylomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Brevipalpus* spp..

- A los nematodos parasitantes de las plantas pertenecen, por ejemplo,
20 *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp., *Globodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp., *Trichodorus* spp., *Bursaphelenchus* spp..

- Los compuestos según la invención pueden emplearse, en caso dado en determinadas concentraciones o bien con determinadas cantidades de aplicación
25 también como herbicidas y microbicidas, por ejemplo a modo de fungicidas, antimicóticos y bactericidas. Estos pueden emplearse también, en caso dado, como productos intermedios o como productos de partida para la síntesis de otros productos activos.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas.

Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de
5 métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas,
10 agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los
15 productos activos, se lleva a cabo según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

Tal como ya se ha indicado anteriormente, pueden tratarse según la invención
20 todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se tratan plantas y variedades de plantas así como sus partes de origen silvestre o que se obtienen por métodos de cultivo biológicos convencionales, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos. En otra forma preferente de realización se tratan plantas y variedades de plantas transgénicas, que hayan sido obtenidas según métodos de ingeniería genética en
25 caso dado en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. La expresión "partes" o bien "partes de plantas" o "componentes de plantas" ha sido anteriormente explicada

Según la invención se tratarán de forma especialmente preferente plantas de las variedades de plantas usuales en el comercio o que se encuentra en utilización.

Según los tipos de plantas o bien las variedades de las plantas, de su localización y de las condiciones de crecimiento (terreno, clima, periodo de vegetación, alimentación) pueden presentarse también por medio del tratamiento según la invención efectos sobreaditivos ("sinérgicos"). De este modo son posibles, por ejemplo, menores cantidades de aplicación y/o ampliaciones del espectro de actividad y/o un reforzamiento del efecto de los, productos empleables según la invención, mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas elevadas o bajas, mayor tolerancia contra la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados, que van mas allá del efecto esperable propiamente dicho.

A las plantas o bien variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) a ser tratadas según la invención, pertenecen todas las plantas, que han adquirido material genético mediante modificación por ingeniería genética, que proporcionan a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("características"). Ejemplos de tales propiedades son, un mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia frente a la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados. Otros ejemplos, especialmente señalables para tales propiedades son la mayor resistencia de las plantas frente a las plagas animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se citaran las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza así como plantaciones de frutales (con los frutos manzana, pera, cítricos y uva), debiéndose señalar

especialmente maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades ("características") se señalarán especialmente la mayor resistencia de las plantas frente a los insectos por medio de las toxinas generadas en las plantas, especialmente aquellas que se generan en las plantas por el material genético procedente de *Bacillus Thuringiensis* (por ejemplo

5 por medio de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como por sus combinaciones), (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("características") se señalarán además especialmente la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos

10 activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, Glyphosate o Phosphinotricin (por ejemplo gen "PAT"). Los respectivos genes, que proporcionan las propiedades deseadas ("características") pueden presentarse también en combinación entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt" pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan bajo los nombre comerciales YIELD GARD® (por ejemplo maíz,

15 algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas que toleran a los herbicidas pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja, que se comercializan bajo los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja),

20 Liberty Link® (tolerancia frente a Phosphinotricin, por ejemplo colza), IMI (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a los herbicidas (cultivadas convencionalmente con tolerancia a los herbicidas) pueden citarse también las variedades comercializadas bajo la denominación Clearfield® (por ejemplo maíz), Evidentemente estas

25 indicaciones son válidas también para las variedades de plantas que se desarrollen en el futuro o bien que se comercialicen en el futuro con estas propiedades ("características") genéticas o que se desarrollen en el futuro.

Las plantas indicadas pueden tratarse de manera especialmente ventajosa, según la invención, con los productos activos de la fórmula (I). Los intervalos preferentes, indicados anteriormente, para las mezclas, son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Debe señalarse especialmente el tratamiento de las
5 plantas con las mezclas especialmente citadas en este texto.

Los productos activos pueden transformarse en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos inyectables, suspensiones, polvos, agentes de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así
10 como microencapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo mediante mezclado de los productos activos con extendedores, es decir, con disolventes líquidos, es decir disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado con empleo de agentes tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios
15 generadores de espuma.

Cuando se emplea agua como extendedor, se pueden utilizar disolventes orgánicos, por ejemplo, como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración preferentemente: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalinas, los hidrocarburos aromáticos clorados y los
20 hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o las parafinas, por ejemplo las fracciones de petróleo, los alcoholes tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, o los disolventes fuertemente polares, tales
25 como la dimetilformamida y el dimetilsulfóxido así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración:
por ejemplo sales de amonio y harinas minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatoméas y los minerales sintéticos molidos, tal como ácido silícico altamente dispersado, el óxido de

aluminio y silicatos; como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo los minerales naturales quebrados y fraccionados, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita, así como los granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y granulados de material orgánico, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o espumantes entran en consideración: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como los ésteres polioxietilenados de los ácidos grasos, los éteres polioxietilenados de los alcoholes grasos, por ejemplo, el alquilarilpoliglicoléter, los alquilsulfonatos, los alquilsulfatos, los arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, las lejías sulfúicas de lignina y la metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulares o en forma de latex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul Prusia y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálicos así como nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, en general, entre 0,1 y 95 % en peso, preferentemente entre 0,5 y 90 % de producto activo.

Los productos activos según la invención pueden presentarse en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezcla con otros productos activos, tales como insecticidas, cebos, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, productos reguladores del crecimiento o herbicidas. A los insecticidas pertenecen por ejemplo ésteres del ácido fosfórico, carbamatos, ésteres del ácido carbónico, hidrocarburos clorados, fenilureas, productos preparados por medio de microorganismos y similares.

Los componentes de mezcla especialmente convenientes son, por ejemplo:

Fungicidas:

- Aldimorph, Ampropyfos, Ampropyfos-potasio, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,
- 5 Benalaxyl, Bonodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacril-isobutilo, Bialaphos, Binapacril, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Butiobat, polisulfuro de calcio, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazin, Carboxin, Carvon, Chinomethionat(Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozycalon, Cufraneb, Cymoxanil,
- 10 Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- 15 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etriadiazol, Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenciclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentihidroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusalfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminio, Fosetyl-sodio, Ftalid,
- 20 Fuberidazol, Furalaxyl, Fumametypr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumercyclos, Guazatin, Hexachlorobenceno, Hexaconazol, Hymexazol, Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealesilat, Iminoctadinetriacetato,
- 25 Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irunamycin, Isoprothiolan, Isovaledione, Kasugamycin, Kresoxim-metilo, preparaciones de cobre, tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, Oxina de cobre y mezcla de Boerdeaux,

- Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanyipirim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfoxax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin, dimetilditiocarbamato de níquel, Nitrothal-isopropilo, Nuarimol,
- 5 Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolilnicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazole, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-sodio, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,
- 10 Quinconazol, Quintozcen (PCNB), Azufre y preparaciones de azufre, Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Tthiophanate-metilo, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-metilo, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutanil, Triazoxid, Trichlamid,
- 15 Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol, Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol, Zarilamid, Zineb, Ziram así como Dagger G,
- 20 OK-8705, OK-8801, α -(1,1-dimetiletil)- β -(2-fenoxietil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol, α -(2,4-diclorofenil)- β -flúor-b-propil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol, α -(2,4-diclorofenil)- β -metoxi-a-metil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,
- 25 α -(5-metil-1,3-dioxan-5-il)- β -[[4-(trifluormetil)-fenil]-metilen]-1H-1,2,4-triazol-1-etanol, (5RS,6RS)-6-hidroxi-2,2,7,7-tetrametil-5-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-3-octanona, (E)-a-(metoxiimino)-N-metil-2-fenoxi-fenilacetamida,

- carbamidato de {2-metil-1-[[[1-(4-metilfenil)-etil]-amino]-carbonil]-propil}-1-isopropilo,
- 1-(2,4-diclorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-etanon-O-(fenilmetil)-oxima,
- 1-(2-metil-1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona,
- 5 1-(3,5-diclorofenil)-3-(2-propenil)-2,5-pirrolidindiona,
- 1-[(diyodometil)-sulfonil]-4-metil-benceno,
- 1-[[2-(2,4-diclorofenil)-1,3-dioxolan-2-il]-metil]-1H-imidazol,
- 1-[[2-(4-clorofenil)-3-feniloxiranil]-metil]-1H-1,2,4-triazol,
- 1-[1-[2-[(2,4-diclorofenil)-metoxi]-fenil]-etenil]-1H-imidazol,
- 10 1-metil-5-nonil-2-(fenilmetil)-3-pirrolidinol,
- 2',6'-dibromo-2-metil-4'-trifluormetoxi-4'-trifluor-metil-1,3-tiazol-5-carboxanilida,
- 2,2-dicloro-N-[1-(4-clorofenil)-etil]-1-etil-3-metil-ciclo-propanocarboxamida,
- 2,6-dicloro-5-(metiltio)-4-pirimidinil-tiocianato,
- 2,6-dicloro-N-(4-trifluormetilbencil)-benzamida,
- 15 2,6-dicloro-N-[[4-(trifluormetil)-fenil]-metil]-benzamida,
- 2-(2,3,3-triyodo-2-propenil)-2H-tetrazol,
- 2-[(1-metiletil)-sulfonil]-5-(triclorometil)-1,3,4-tiadiazol,
- 2-[[6-deoxi-4-O-(4-O-metil-β-D-glicopiranosil)-α-D-glucopiranosil]-amino]-4-metoxi-1H-pirrol[2,3-d]pirimidin-5-carbonitrilo,
- 20 2-aminobutano,
- 2-bromo-2-(bromometil)-pentandinitrilo,
- 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida,
- 2-cloro-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(isotiocianatometil)-acetamida,
- 2-fenilfenol(OPP),
- 25 3,4-dicloro-1-[4-(difluormetoxi)-fenil]-1H-pirrol-2,5-diona,
- 3,5-dicloro-N-[cian[(1-metil-2-propinil)-oxi]-metil]-benzamida,
- 3-(1,1-dimetilpropil)-1-oxo-1H-inden-2-carbonitrilo,
- 3-[2-(4-clorofenil)-5-etoxi-3-isoxazolidinil]-piridina,

- 4-cloro-2-cian-N,N-dimetil-5-(4-metilfenil)-1H-imidazol-1-sulfonamida,
 4-metil-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 8-(1,1-dimetiletil)-N-etil-N-propil-1,4-dioxaspiro[4,5]de-can-2-metanamina,
 8-hidroxiquinolinsulfato,
- 5 9H-xanten-9-carboxílico-2-[(fenilamino)-carbonil]-hidrazida,
 bis-(1-metiletil)-3-metil-4-[(3-metilbenzoi)-oxi]-2,5-tio-fendicarboxilato,
 cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol,
 hidrocloreto de cis-4-[3-[4-(1,1-dimetilpropil)-fenil-2-metilpropil]-2,6-dimetil-morfo-
 lina,
- 10 etil-[(4-clorofenil)-azo]-cianoacetato,
 bicarbonato de potasio,
 Methantetrathiol-sal sódica,
 metil-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato,
 metil-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(5-isoxazolilcarbonil)-DL-alaninato,
- 15 metil-N-(cloroacetil)-N-(2,6-dimetilfenil)-DL-alaninato,
 N-(2,3-dicloro-4-hidroxifenil)-1-metil-ciclohexancarboxamida,
 N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-N-(tetrahidro-2-oxo-3-furanil)-acetamida,
 N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-N-(tetrahidro-2-oxo-3-tienil)-acetamida,
 N-(2-cloro-4-nitrofenil)-4-metil-3-nitro-bencenosulfonamida,
- 20 N-(4-ciclohexilfenil)-1,4,5,6-tetrahidro-2-pirimidinamina,
 N-(4-hexilfenil)-1,4,5,6-tetrahidro-2-pirimidinamina,
 N-(5-cloro-2-metilfenil)-2-metoxi-N-(2-oxo-3-oxazolidinil)-acetamida,
 N-(6-metoxi)-3-piridinil)-ciclopropancarboxamida,
 N-[2,2,2-tricloro-1-[(cloroacetil)-amino]-etil]-benzamida,
- 25 N-[3-cloro-4,5-bis-(2-propinilo)-fenil]-N'-metoxi-metan-imidamida,
 N-formil-N-hidroxi-DL-alanina, sal sódica
 O,O-dietil-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforamidotioato,
 O-metil-S-fenil-fenilpropilfosforamidotioato,
 S-metil-1,2,3-benzotiadiazol-7-carbotioato,

spiro[2H]-1-benzopiran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-ona.

Bactericidas:

- Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, Kasugamycin, Octhilinon, ácido furanocarboxílico, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin,
- 5 Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas/Acaricidas/Nematicidas:

- Abamectin, Acephat, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,
- 10 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, bacillus subtilis, bacillus thuringiensis, Baculovirus, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, BPMT, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxin, Butylpiridaben,
- 15 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,
- 20 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-metilo, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodio, Dofenapyn,
- Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopffthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Ethofenprox, Etoxazole, Etrimphos,
- 25 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxido, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocylthrin, Flucyclozuron, Flucylthrin, Flufenoxuron, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

- Granulosevirus,
 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,
 Imidacloprid, Isazophos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,
 Poliedrovirus nucleares,
- 5 Lamda-cyhalothrin, Lufenuron,
 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
 Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenizide,
 Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos,
 Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron,
- 10 Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M,
 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat,
 Phosalon, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M,
 Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyrachlophos,
 Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxifen,
- 15 Quinalphos.
 Ribavirin,
 Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos,
 Taufluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimphos, Teflubenzuron,
 Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-cypermethrin,
- 20 Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hidrógeno oxalato, Thiodicarb,
 Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate,
 Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,
 Varnidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii,
 YI 5302,
- 25 Zeta-cypermethrin, Zolaprofos,
 (1R-cis)-[5-(fenilmetil)-3-furanil]-metil-3-[(dihidro-2-oxo-3(2H)-furaniliden)-metil]-
 2,2-dimetilciclopropanocarboxilato
 (3-fenoxifenil)-metil-2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato
 1-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]tetrahidro-3,5-dimetil-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imina

- 2-(2-cloro-6-fluorfenil)-4-[4-(1,1-dimetiletil)fenil]-4,5-dihidro-oxazol
 2-(acetiloxi)-3-dodecil-1,4-naftalindiona
 2-cloro-N-[[[4-(1-feniletoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida
 2-cloro-N-[[[4-(2,2-dicloro-1,1-difluoretoksi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida
 5 3-metilfenil-propilcarbarnato
 4-[4-(4-etoxifenil)-4-metilpentil]-1-fluor-2-fenoxi-benceno
 4-cloro-2-(1,1-dimetiletil)-5-[[2-(2,6-dimetil-4-fenoxifenoxi)etil]tio]-3(2H)-
 piridazinona
 4-cloro-2-(2-cloro-2-metilpropil)-5-[(6-yodo-3-piridinil)metoxi]-3(2H)-piridazinona
 10 4-cloro-5-[(6-cloro-3-piridinil)metoxi]-2-(3,4-diclorofenil)-3(2H)-piridazinona
 Bacillus thuringiensis cepa EG-2348
 [2-benzoil-1-(1,1-dimetil)-hidrazida del ácido benzoico
 butanoato de 2,2-dimetil-3-(2,4-diclorofenil)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo
 [3-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2-tiazolidiniliden]-cianamida
 15 dihidro-2-(nitrometilen)-2H-1,3-tiazina-3(4H)-carboxaldehido
 etil-[2-[[1,6-dihidro-6-oxo-1-(fenilmetil)-4-piridazinil]oxi]etil]-carbarnato
 N-(3,4,4-trifluor-1-oxo-3-butenil)-glicina
 N-(4-clorofenil)-3-[4-(difluormetoxi)fenil]-4,5-dihidro-4-fenil-1H-pirazol-1-
 carboxamida
 20 N-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]-N'-metil-N''-nitroguanida
 N-metil-N'-(1-metil-2-propenil)-1,2-hidrazindicarbotioamida
 N-metil-N'-2-propenil-1,2-hidrazindicarbotioamida
 O,O-dietil-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforoamidotioato.

También es posible una mezcla con otros productos activos conocidos, tales
 25 como herbicidas o con abonos y reguladores del crecimiento.

Los productos activos según la invención pueden presentarse además, cuando se
 utilizan como insecticidas, en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las
 formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con

sinérgicos. Los sinérgicos son los compuestos mediante los cuales se aumenta el efecto de los productos activos, sin que el sinérgico agregado tenga que ser activo en si mismo.

El contenido en producto activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones usuales en el comercio puede variar dentro de amplios límites. La
5 concentración de producto activo de las formas de aplicación puede encontrarse entre 0,0000001 hasta 95 % en peso de producto activo preferentemente entre 0,0001 y 1 % en peso.

La aplicación se lleva a cabo de una manera adaptada a las formas de aplicación.

En el empleo contra las plagas de la higiene y de los productos almacenados se
10 caracterizan los productos activos por un efecto residual excelente sobre madera y arcilla así como por la buena estabilidad a los álcalis sobre soportes enalados.

Los productos activos según la invención no solamente son activos contra las plagas de las plantas, de la higiene y de los productos almacenados, sino también en el sector de la medicina veterinaria contra parásitos de los animales (ectoparásitos) tales
15 como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros migratorios, moscas (chupadoras y picadoras), larvas parasitantes de moscas, piojos, liendres del cabello, liendres de las plumas y pulgas. A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los anopluros, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp..

20 Del orden de los malofagidos y de los sub-órdenes amblicerinos así como isqunocerinos, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp..

25 Del orden de los dípteros y de los sub-órdenes nematocerinos así como braquicerinos, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomya* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp.,

Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypodema spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Del orden de los sifonapteridos, por ejemplo Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

- 5 Del orden de los heteropteridos, por ejemplo Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Del orden de los blataridos, por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blatella germanica, Supella spp..

- De las sub-clase de los ácaros (Acarida) y del orden de los meta- así como
10 mesoestigmatos, por ejemplo Argas spp., Ornithodoros spp., Otabius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

- Del orden de los actinédidos (Prostigmata) y acarididos (Astigmata), por
15 ejemplo Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

- 20 Los productos activos de la fórmula (I) según la invención son adecuados también para la lucha contra los artrópodos, que atacan a los animales útiles en agricultura tales como, por ejemplo, vacas, corderos, cabras, caballos, chanchos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, demás animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros de salón, peces de acuario
25 así como a los denominados animales de ensayo, tales como, por ejemplo, hámster, conejillos de Indias, ratas y ratones. Mediante la lucha contra estos artrópodos se evitaban casos de fallecimiento y reducciones de la productividad (en leche, carne, lana, pieles, huevos, miel, etc), de manera que, mediante el empleo de los productos activos

según la invención, es posible un mantenimiento de los animales mas económico y mas sencillo.

La aplicación de los productos activos según la invención se lleva a cabo en el sector de la veterinaria de forma conocida mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, tabletas, cápsulas, bebidas, grageas, granulados, pastas, bolis, por medio del procedimiento a través de la comida "feed-through", de supositorios, mediante administración parenteral, tal como, por ejemplo, mediante inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantatos, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dermal en forma, por ejemplo de inmersión o de baño (Dippen), pulverizado (Spray), regado superficial (Pour-on y Spot-on), de lavado, de empolvado así como con ayuda de cuerpos moldeados que contengan el producto activo tales como collarines, marcas para las orejas, marcas para el rabo, bandas para las extremidades, cabestros, dispositivos de marcado, etc.

Cuando se emplean para ganado doméstico, aves, animales domésticos etc. pueden emplearse los productos activos como formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, agentes capaces de extenderse), que contengan los productos activos en cantidades de 1 a 80 % en peso, directamente o tras dilución de 100 hasta 10.000 veces o pueden emplearse a modo de baño químico.

Además se ha encontrado que los productos activos según la invención muestran un elevado efecto insecticida contra insectos, que destruyen los materiales industriales.

De manera ejemplificativa y preferente - sin embargo sin carácter limitativo - pueden citarse los insectos siguientes:

Escarabajos, tales como

- 25 *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpine*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*; *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron*

223
222

spec., *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon* spec., *Dinoderus minutus*.

Himenópteros, tales como

Sirex juvencus, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

5 Termitas, tales como

Kaloterms flavicollis, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*.

Tisanuros, tal como *Lepisma saccharina*.

10 Por materiales industriales se entenderán en el contexto presente materiales no-vivos, tales como, preferentemente, materiales sintéticos, pegamentos, colas, papel y cartón, cuero, madera y productos de elaboración de la madera y pinturas.

De una manera muy especial, los materiales a ser protegidos contra el ataque de los insectos están constituidos por madera y productos de elaboración de la madera.

15 Por madera y productos de elaboración de la madera, que pueden ser protegidos por medio de los agentes según la invención o de las mezclas que los contengan, deberá entenderse, por ejemplo: madera para la construcción, vigas de madera, traviesas para ferrocarril, piezas para puentes, costillas para barcas, vehículos de madera, cajas, paletas, contenedores, postes telefónicos, revestimientos de madera, ventanas y puertas
20 de madera, contrachapado de madera, placas de contrachapado, trabajos de carpintería o productos de madera, que encuentran aplicación, de una manera muy general, en el hogar o en la industria de la construcción.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de concentrados o de formulaciones usuales en general tales como polvos, granulados, soluciones,
25 suspensiones, emulsiones o pastas.

Las citadas formulaciones puede prepararse en forma en si conocida, por ejemplo por mezclado de los productos activos con al menos un disolvente o bien diluyente, emulsionante, dispersantes y/o aglutinante o agente de fijación, repelente del agua, en caso dado secantes y estabilizantes contra los UV y, en caso dado,

228
223

colorantes y pigmentos así como otros agentes auxiliares de elaboración.

Los agentes o concentrados insecticidas a ser empleados para la protección de la madera y de los materiales de madera, contienen el producto activo según la invención en una concentración de 0,0001 hasta 95 % en peso, especialmente de 0,001 hasta 60 % en peso.

Las cantidades de los agentes o bien de los concentrados empleados dependen del tipo y del origen de los insectos y del medio. Las cantidades de aplicación óptimas pueden determinarse respectivamente por medio de series de ensayos previamente a la aplicación. En general sin embargo es suficiente con emplear de 0,0001 hasta 20 % en peso, preferentemente de 0,001 hasta 10 % en peso del producto activo; referido al material a ser protegido.

Como disolvente y/o diluyente sirve un disolvente o una mezcla de disolventes órgano-químicos y/o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos, oleaginosos o tipo oleaginoso, difícilmente volátiles y/o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos polares y/o agua y, en caso dado un emulsionante y/o humectante.

Como disolventes órgano-químicos se emplearán, preferentemente, disolventes oleaginosos o de tipo oleaginoso, con un índice de evaporación situado por encima de 35 y un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente situado por encima de 45°C. A modo de tales disolventes difícilmente volátiles, insolubles en agua, oleaginosos o de tipo oleaginoso, se emplearán aceites minerales correspondientes o sus fracciones aromáticas o mezclas de disolventes que contengan aceites minerales, preferentemente bencina para ensayos, petróleo y/o alquilbenceno.

Ventajosamente se emplearán aceites minerales con un intervalo de ebullición de 170 hasta 220°C, bencina para ensayos con un intervalo de ebullición de 170 hasta 220°C, aceite para husillos con un intervalo de ebullición de 250 hasta 350°C, petróleo o bien hidrocarburos aromáticos con un intervalo de ebullición de 160 hasta 280°C, aceite de terpentina y similares.

225
22A

En una forma de realización preferente se emplearán hidrocarburos alifáticos líquidos con un intervalo de ebullición de 180 hasta 210°C o mezcla de elevado punto de ebullición de hidrocarburos aromáticos y alifáticos con un intervalo de ebullición de 180 hasta 220°C y/o aceite para husillos y/o monocloronaftalina, preferentemente α -
5 monocloronaftalina.

Los disolventes orgánicos, difícilmente volátiles, oleaginosos o de tipo oleaginoso, con un índice de evaporación situado por encima de 35 y con un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente por encima de 45°C, pueden substituirse parcialmente por disolventes órgano-químicos ligeros o de volatilidad
10 media, con la condición de que la mezcla de disolventes presente un índice de evaporación situado por encima de 35 y un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente por encima de 45°C, y que la mezcla insecticida-fungicida sea soluble o emulsionable en esta mezcla de disolventes.

Según una forma de realización preferente se substituirá una parte del disolvente
15 o de la mezcla de disolventes órgano-químicos o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos alifáticos, polares. Preferentemente se emplearán disolventes órgano-químicos alifáticos que contengan grupos hidroxilo y/o éster y/o éter, tales como, por ejemplo, glicoléter, ésteres o similares.

Como aglutinantes órgano-químicos se emplearán en el ámbito de la presente
20 invención las resinas sintéticas y/o los aceites secantes de fraguado, en si conocidos, diluibles con agua y/o solubles o dispersables o bien emulsionables en los disolventes órgano-químicos empleados, especialmente aglutinantes constituidos por o que contengan resina acrílica, una resina vinílica, por ejemplo acetato de polivinilo, resina de poliéster, resina de policondensación o de poliadición, resina de poliuretano, resina
25 alquídica o bien resina alquídica modificada, resina fenólica, resina hidrocarbonada tal como resina de indeno-cumarona, resina de silicona, aceites secantes vegetales y/o secantes y/o aglutinantes secantes físicos a base de una resina natural y/o sintética.

La resina sintética, empleada como aglutinante, puede emplearse en forma de una emulsión, dispersión o solución. Como aglutinantes pueden emplearse también betún o sustancias bituminosas hasta un 10 % en peso. De manera complementaria pueden emplearse colorantes, pigmentos agentes repelentes del agua, correctores del
5 olor e inhibidores o agentes protectores contra la corrosión en si conocidos, y similares.

Es preferente emplear en el medio o en el concentrado, según la invención, como aglutinante órgano-químico al menos una resina alquídica o bien una resina alquídica modificada y/o un aceite vegetal secante. Preferentemente se emplearán según la invención resinas alquídicas con un contenido en aceite mayor que el 45 % en peso,
10 preferentemente del 50 hasta el 68 % en peso.

El aglutinante citado puede substituirse parcial o totalmente por un agente(mezcla) de fijación o por una plastificante(mezcla). Estos aditivos deben evitar una volatilización de los productos activos así como una cristalización o bien una precipitación. Preferentemente substituyen a un 0,01 hasta un 30 % del aglutinante
15 (referido al 100 % del aglutinante empleado).

Los plastificantes son de la clase química de los ésteres del ácido ftálico tales como ftalato de dibutilo, de dioctilo o de bencilbutilo, ésteres del ácido fosfórico, tal como el fosfato de tributilo, ésteres del ácido adípico, tal como el adipato de di-(2-etilhexilo), estearatos tales como estearato de butilo o estearato de amilo, oleatos tal
20 como oleato de butilo, éteres de glicerina o glicoléteres de elevado peso molecular, ésteres de glicerina así como ésteres del ácido p-toluenosulfónico.

Los agentes de fijación están basados químicamente en polivinilal-quiléteres tal como el polivinilmetiléter o en cetonas tales como benzofenona, etilen-benzofenona.

Como disolvente o bien diluyente entra en consideración especialmente el agua,
25 en caso dado en mezcla con uno o varios de los disolventes o bien diluyentes, emulsionante y dispersantes órgano-químicos anteriormente citados.

Se consigue una protección especialmente efectiva de la madera mediante los procedimientos de impregnación a escala industrial, por ejemplo procedimientos al vacío, al vacío doble o a presión.

Los agentes listos para su aplicación pueden contener en caso dado otros insecticidas y, en caso dado uno o varios fungicidas.

Como componentes adicionales de la mezcla entran en consideración preferentemente los insecticidas y fungicidas citados en la WO 94/29 268. Los
5 compuestos citados en este documento constituyen, expresamente, parte integrante de la presente solicitud.

Como componentes de mezcla muy especialmente preferentes entran en consideración insecticidas, tales como Chlorpyrifos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-
10 25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyphenoxid y Triflumuron,
así como fungicidas tales como Epoxiconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfuanid, Tolyfluanid, 3-yodo-2-propinil-butilcarbarnato, N-octil-isotiazolin-3-ona y 4,5-dicloro-
15 N-octilisotiazolin-3-ona.

Al mismo tiempo pueden emplearse las combinaciones de los productos activos según la invención para la protección contra la proliferación de organismos sobre objetos, especialmente sobre los cuerpos de buques, tamices, redes, construcciones, instalaciones portuarias e instalaciones de señalización, que entran en
20 contacto con agua de mar o con agua salubre.

La proliferación de organismos debida a Oligochaeten sesiles, tales como tubicideos calcáreos así como debido a los bivalvos y especies del grupo de los lepadomorfos (bellotas de mar), tal como diversos tipos de Lepas y Scalpellum o debido a tipos del grupo de los balanomorfos (percebes), tales como especies de
25 Balanus, o Pollicipes, aumentan la resistencia al rozamiento de los barcos y conduce, como consecuencia de un mayor consumo de energía y además debido a las frecuentes estancias en dique seco, a un claro aumento de los costes de explotación.

Además de la proliferación de organismos debida a las algas, por ejemplo Ectocarpus sp. y Ceramium sp., tiene un significado especial en particular la

proliferación de organismos debida a grupos sesiles de entomostráceos, que se agrupan bajo el nombre de Cirripedia (crustáceos cirrípedos).

Se ha encontrado ahora, sorprendentemente, que las combinaciones de los productos activos según la invención presentan un efecto antiincrustante
5 (antiproliferación de organismos) excelente

Mediante el empleo de las combinaciones de los productos activos según la invención puede desistirse al empleo de metales pesados tales como por ejemplo en los sulfuros de bis(trialquilestaño), laurato de tri-n-butilestaño, cloruro de tri-n-butilestaño, óxido cuproso (I), cloruro de trietilestaño, tri-n-butil-(2-fenil-4-
10 clorofenoxi)-estaño, óxido de tributilestaño, disulfuro de molibdeno, óxido de antimonio, butil-titanato polímero, cloruro de fenil-(bispiridin)-bismuto, fluoruro de tri-n-butilestaño, etilenbistiocarbamato de manganeso, dimetilditiocarbamato de cinc, etilenbistiocarbamato de cinc, sal de cinc del 2-piridintiol-1-óxido, etilen-bistio-
carbamato de bisdimetilditiocarbamoilcinc, etilen-bisditiocarbamato cuproso (I),
15 tiocianato de cobre, naftenato de cobre y halogenuros de tributilestaño o puede reducirse decisivamente la concentración de estos compuestos.

Las pinturas antiincrustantes listas para su aplicación contienen, en caso dado, además, otros productos activos, preferentemente alguicidas, fungicidas, herbicidas, molusquicidas o bien con otros productos activos antiincrustantes.

20 Como componentes de la combinación para los agentes antiincrustantes según la invención son adecuados, preferentemente:

Alguicidas tales como

2-tec.-butilamino-4-ciclopropilamino-6-metiltio-1,3,5-triazina, Dichlorophen,
Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen,
25 Quinoclamine y Terbutryn;

Fungicidas tales como

S,S-dióxido de la ciclohexilamida del ácido benzo[b]-tiofencarboxílico,
Dichlofluanid, Fluorfolpet, 3-yodo-2-propinil-butilcarbamato, Tolyfluanid y azoles
tales como

Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propioconazole y Tebuconazole;

Molusquicidas tales como

Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb y Trimethacarb;

5 o agentes antiincrustantes tradicionales tales como

4,5-dicloro-2-octil-4-isotiazolin-3-ona, diyodometilparatrilsulfona, 2-(N,N-dimetil-tiocarbamoilitio)-5-nitrotiazilo, sales de potasio, de cobre, de sodio y de cinc del 2-piridintiol-1-óxido, piridin-trifenilborano, tetrabutildiestannoxano, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, 2,4,5,6-tetraclorisoftalonitrilo, disulfuro de tetrametil-
10 tiouram y 2,4,6-triclorofenil-maleinimida.

Los agentes antiincrustantes empleados contienen las combinaciones de productos activos según la invención en una concentración de 0,001 hasta 50 % en peso, especialmente de 0,01 hasta 20 % en peso.

Los agentes antiincrustantes según la invención contienen además usualmente
15 los componentes frecuentes, pero sin limitarse a los mismos, tales como por ejemplo los que se han descrito en Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732 y Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973.

Las pinturas antiincrustantes contienen, además de los productos activos alguicidas, fungicidas, molusquicidas e insecticidas según la invención, especial-
20 mente aglutinantes.

Ejemplos de aglutinantes reconocidos son cloruro de polivinilo en un sistema disolvente, caucho clorado en un sistema disolvente, resinas acrílicas en un sistema disolvente especialmente en un sistema acuoso, sistemas de copolímeros de cloruro de vinilo/acetato de vinilo en forma de dispersiones acuosas o en forma de sistemas
25 en disolventes orgánicos, cauchos de butadieno/estireno/acrilonitrilo, aceites desecantes tales como aceite de linaza, ésteres resínicos o ésteres resínicos modificados en combinación con alquitranes o betunes, asfalto así como epoxi-compuestos, pequeñas cantidades de clorocaucho, polipropileno clorado y resinas vinílicas.

En caso dado las pinturas contienen también pigmentos inorgánicos, pigmentos orgánicos o colorantes, que preferentemente sean insolubles en el agua marina. Además las pinturas pueden contener materiales tales como colofonio para posibilitar una liberación controlada de los productos activos. Las pinturas pueden
5 contener además plastificantes, agentes modificantes que influyan sobre las propiedades reológicas así como otros componentes tradicionales. También en sistemas antiincrustantes de auto-pulido puede incorporarse los compuestos según la invención o las mezclas anteriormente citadas.

Los productos activos según la invención son adecuadas para combatir las
10 pestes animales, especialmente los insectos, arácnidos y ácaros, que se presentan en los recintos cerrados, tales como, por ejemplo, viviendas, instalaciones fabriles, oficinas, cabinas de vehículos automóviles y similares. Estas pueden emplearse para combatir estas pestes en productos insecticidas para el hogar. Estas son activas contra tipos sensibles y resistentes así como contra todos los estadios de desarrollo. A estas pestes
15 pertenecen:

Del orden de los escorpionideos, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

Del orden de los ácaros, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanysus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*,
20 *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

Del orden de los araneos, por ejemplo *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Del orden de los opiliones, por ejemplo *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

25 Del orden de los diplopodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp..

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp..

Del orden de los cigentomos, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma sacharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Del orden de los blatáridos, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Blatella germanica*, *Blatella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

5 Del orden de los saltatorios, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp.

Del orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp.,

10 *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*,

15 *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achoria grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*,

20 *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

25 Del orden de los anopluros, por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

La aplicación en el sector de los insecticidas domésticos se lleva a cabo sola o en combinación con otros productos activos adecuados tales como ésteres del ácido

232
231

fosfórico, carbamatos, piretroides, reguladores del crecimiento o productos activos de otras clases de insecticidas conocidos,

La aplicación se lleva a cabo en aerosoles, agentes para pulverización sin presión, por ejemplo esprays por bombeo y por pulverizado, dispositivos automáticos de nebulizado, nebulizadores, generadores de espuma, geles, productos para evaporadores con plaquetas para los evaporadores de celulosa o de material sintético, evaporadores de líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores accionados mediante ventilador, sistemas evaporadores sin consumo de energía o bien pasivos, papeles contra las polillas, bolsitas contra las polillas y geles contra las polillas, en forma de granulados o de polvo, en cebos esparcibles o en estaciones para cebos.

Los productos activos según la invención se pueden emplear como defoliantes, desecantes, agentes herbicidas y especialmente como agentes para eliminar las malas hierbas. Por malas hierbas, en el más amplio sentido, se han de entender las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. El hecho de que las sustancias, según la invención, actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de la cantidad empleada

Los productos activos según la invención pueden emplearse por ejemplo en las plantas siguientes:

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

Cultivos dicotiledóneos de las clases: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Malas hierbas monocotiledóneas de las clases: 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, 5 Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Cultivos monocotiledóneos de las clases: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

El empleo de los productos activos según la invención, no está sin embargo, 10 limitado en forma alguna estas clases, sino que se extienden en igual forma también sobre otras plantas.

Los productos activos según la invención son adecuados, en función de la concentración, para combatir totalmente las hierbas malas, por ejemplo, en instalaciones industriales y viarias y en caminos y plazas, con y sin crecimiento de árboles. Del 15 mismo modo, se pueden emplear los compuestos para combatir las hierbas malas en cultivos permanentes, por ejemplo, en instalaciones forestales, de árboles de adorno, de árboles frutales, de viñedos, de árboles cítricos, de nogales, de plátanos, de café, de té, de goma de palmas de aceite, de cacao, de frutos de bayas y de húpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas 20 en forma selectiva en los cultivos mono-anales.

Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad sobre el terreno y sobre las partes aéreas de las plantas. Son adecuados en cierta medida también para combatir de manera selectiva las malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos 25 monocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en el procedimiento de post-brote.

Los productos activos según la invención pueden emplearse también, en caso dado, a determinadas concentraciones y cantidades de aplicación también para combatir las plagas animales y las enfermedades de las plantas fúngicas o bacterianas. Pueden

emplearse, en caso dado, también como productos intermedios y como productos de partida para la síntesis de otros productos activos.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de
5 espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como micro-encapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los productos activos con materiales extendedores, esto es, con disolventes
10 líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado, empleando agentes tensioactivos, esto es, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

En el caso de emplear agua como material de carga se puede emplear, por ejemplo, también disolventes orgánicos como agentes disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran especialmente en consideración: los hidrocarburos
15 aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los cloroben-cenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o las parafinas, por ejemplo, las fracciones de petróleo crudo, los aceites minerales y vegetales, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus ésteres y
20 éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutylcetona, o ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo,
25 attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molturados, tales como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo, minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como

granulados de materiales orgánicos, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo, los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, éteres polioxietilenados de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, lixiviaciones sulfiticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex, tales como goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden emplear colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul ferrocianico y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y de ftalocianina metálicos y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre un 0,1 hasta un 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,5 y un 90 %.

Los productos activos según la invención pueden emplearse como tales o en sus formulaciones incluso en mezcla con herbicidas conocidos y/o con productos que mejoren la compatibilidad para con las plantas de cultivo ("protectores") para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles formulaciones acabadas o mezclas de tanque. También son posibles con agentes para combatir las malas hierbas, que contengan uno o varios herbicidas y protectores conocidos.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo: Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodio), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio),

- Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinmethylin, Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop (-
- 5 propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-metilo), Cloransulam(-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallyate, Dicamba, Diclofop(-metilo), Diclosulam, Diethatyl(-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn,
- 10 Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop(-isopropilo), Flamprop(-isopropilo-L), Flamprop(-metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet,
- 15 Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flupyrasulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-isopropilamonio), Halosafen, Haloxypop(-etoxietilo),
- 20 Haloxypop(-P-metilo), Hexazinone, Imazamethabenz(-metilo), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron(-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron,
- 25 Metobenzuron, Metobromuron, (alfa-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclonofone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor,

335
736

- Primisulfuron(-metilo), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-etilo), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-metilo), Pyriothiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, 5 Quizalofop(-P-etilo), Quizalofop(-P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, 10 Tridiphane, Trifluralin, Triflurosulfuron, Tritosulfuron.

También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

- 15 Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de los mismos mediante diluciones ulteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados. El empleo se lleva a cabo en forma usual por ejemplo mediante riego, pulverización, aspersión, esparcido.

- 20 Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

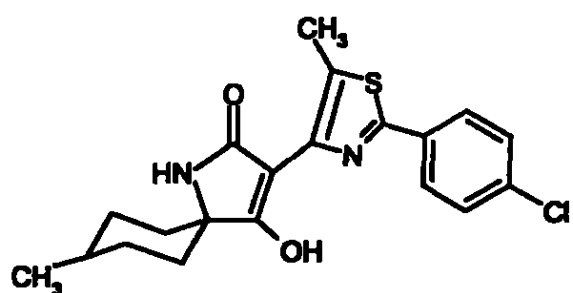
- La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. En general las 25 cantidades empleadas se sitúa entre 1 g y 10 kg de producto activo por hectárea de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hectárea.

La obtención y el empleo de las sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención.

238
239

Ejemplo I-1-A-a-1



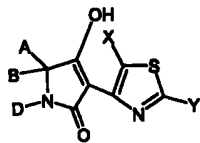
Se disponen 3,70 g (0,031 moles) de terc.-butilato de potasio en 26 ml de DMF anhidra, 0°C, y se añade 6 g del compuesto según el ejemplo II-1 en 12 ml de DMF anhidra. Se agita durante 1 hora a 20°C.

La solución de la reacción se vierte en 200 ml de agua helada y se acidifica a 0-10°C. A continuación se separa el precipitado mediante filtración por succión y se recrystaliza.

Rendimiento: 4,66 g (Δ 83 % de la teoría), Fp. > 260°C.

10 DMF (dimetilformamida).

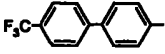
De manera análoga a la del ejemplo (I-1-A-a-1) y según las indicaciones generales para la obtención se preparan los compuestos de la fórmula (I-1-A-a) siguientes

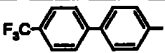
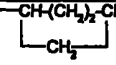
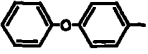


(I-1-A-a)

Ejemplo n°	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isómero
I-1-A-a-2	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	230	-
I-1-A-a-3	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		246	B
I-1-A-a-4	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		>250	B
I-1-A-a-5	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ O-(CH ₂) ₂ -		>265	-
I-1-A-a-6	-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>250	-
I-1-A-a-7	-C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		250	B
I-1-A-a-8	-CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		244	B
I-1-A-a-9	-CH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		406	B
I-1-A-a-10	-C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	176	-
I-1-A-a-11	-CH ₃	C ₆ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		235	B
I-1-A-a-12	-CH ₃	2-Cl, 6-OCH ₃ -C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		249	B

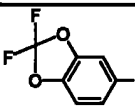
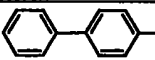
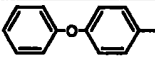
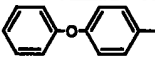
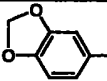
238

Ejemplo nº	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isómero
I-1-A-a-13	-CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	228	-
I-1-A-a-14	-CH ₃	C ₆ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	177	-
I-1-A-a-15	-C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		204	B
I-1-A-a-16	-CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		235	B
I-1-A-a-17	-CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		235	B
I-1-A-a-18	-CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		258	B
I-1-A-a-19	-CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	172	-
I-1-A-a-20	-CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	CH ₃	CH ₃	211	-
I-1-A-a-21	-CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	220	-
I-1-A-a-22	-CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	218	-
I-1-A-a-23	-C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃		-
I-1-A-a-24	Br	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			B
I-1-A-a-25	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			B
I-1-A-a-26	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			B
I-1-A-a-27	Br	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	143	-
I-1-A-a-28	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	208	-

Ejemplo nº	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isómero
I-1-A-a-29	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	226	-
I-1-A-a-30	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -	H				β
I-1-A-a-31	C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	162	-
I-1-A-a-32	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		261	α
I-1-A-a-33	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄	H	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		245	β
I-1-A-a-34	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	212	-
I-1-A-a-35	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	H	CH ₃	CH ₃	139	-
I-1-A-a-36	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		220	α
I-1-A-a-37	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	H	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		205	β
I-1-A-a-38	i-C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		274	β
I-1-A-a-39	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	181	-

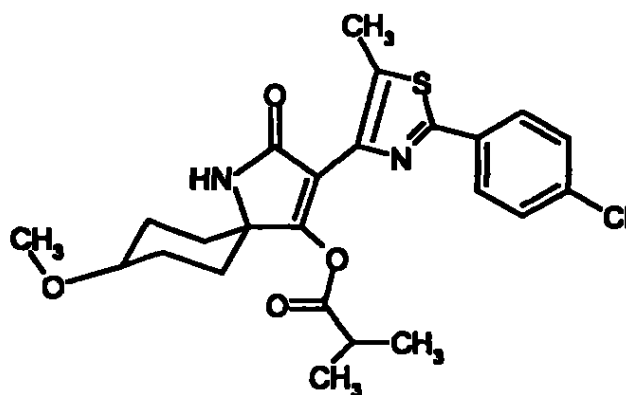
118

241

Ejemplo n°	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isómero
I-1-A-s-40	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	205	-
I-1-A-s-41	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	254	-
I-1-A-s-42	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		225	β
I-1-A-s-43	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ C- C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		252	β
I-1-A-s-44	CH ₃	4-Cl- C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -		291	-
I-1-A-s-45	CH ₃	4-Cl- C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₂		H	197	-
I-1-A-s-46	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		252	α
I-1-A-s-47	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	121	-
I-1-A-s-48	CH ₃	4-Cl- C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₄ -		H		

242

Ejemplo I-1-A-b-1.

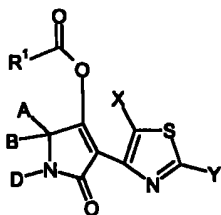


Se disponen 0,81 g del compuesto según el ejemplo (I-1-a-2) en 10 ml de acetato de etilo anhidro y se calientan con 0,3 ml (2,2 mmoles) de trietilamina a reflujo. A continuación se añaden 0,25 ml (0,00 22 moles) de cloruro de isobutirilo en 5 ml de acetato de etilo anhidro y se calienta a reflujo.

Una vez concluida la reacción (controles mediante DC) se elimina el disolvente por destilación y el residuo se recoge en diclorometano, se lava dos veces con 120 ml de NaOH 0,5 N, se seca y se concentra en el evaporador rotativo. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano/acetato de etilo, 3:1).

Rendimiento: 0,2 g (Δ 21 % de la teoría), Fp 208°C.

De manera análoga a la del ejemplo (I-1-A-b-1) y de acuerdo con las indicaciones generales para la obtención se preparan los compuestos de la fórmula (I-1-A-b) siguientes

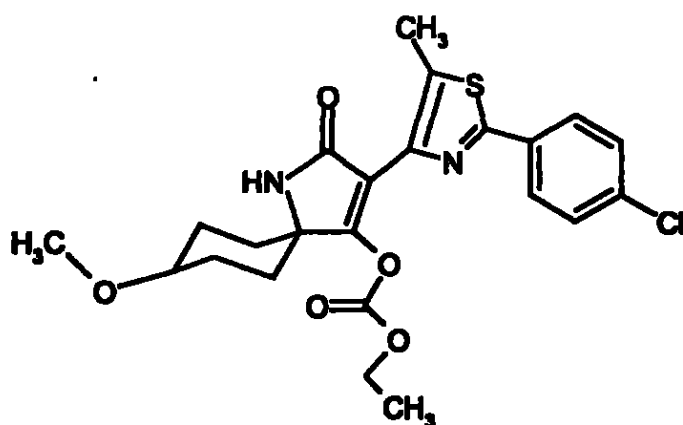


(I-1-A-b)

Ej n°	X	Y	D	A	B	R ¹	Fp°C	Isómero
I-1-A-b-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			273	-
I-1-A-b-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			249	8

242

Ejemplo I-1-A-c-1.



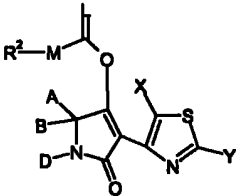
Se disponen 0,69 g del compuesto según el ejemplo I-1-a-2 en 10 ml de diclorometano anhidro y se combinan, a 10°C, con 0,24 ml (1,7 mmoles) de trietilamina.

A continuación se añaden 0,17 ml (1,7 mmoles) de cloroformiato de etilo en 1 ml de diclorometano anhidro y se agita a temperatura ambiente.

Una vez concluida la reacción (controles mediante DC) se elimina el disolvente por destilación y el residuo se recoge en diclorometano, se lava dos veces con 10 ml de NaOH 0,5 N, se seca y se concentra en el evaporador rotativo. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano/acetato de etilo 3:1).

Rendimiento: 0,58 g (Δ 71 % de la teoría), Fp. 211°C.

De manera análoga a la del ejemplo (I-1-A-c-1) y de acuerdo con las indicaciones generales para la obtención se preparan los compuestos de la fórmula (I-1-A-c)



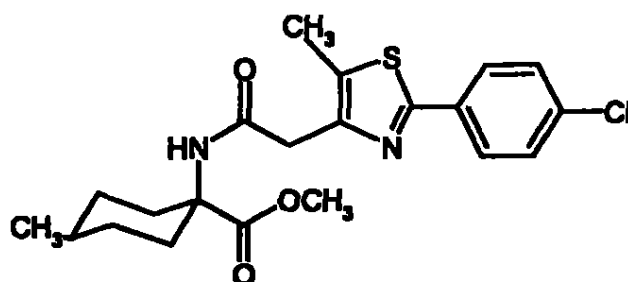
(I-1-A-c)

Ej n°	X	Y	D	A	B	L	M	R ²	Fp°C	Isómero
I-1-A-c-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O		-	B
I-1-A-c-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O		292	B
I-1-A-c-4	CH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O	C ₂ H ₅	-	B

2/6

287
246

Ejemplo II-A-1



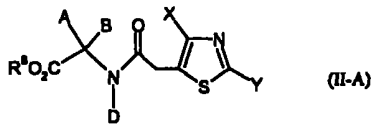
Se añaden a 4,61 g del hidrocloreuro del 4-metil-1-amino-ciclohexano-1-carboxilato de metilo, en 80 ml de tetrahidrofurano anhidro, 6,6 ml de trietilamina y se agita durante 3 minutos. Se añaden 5,3 g del ácido 4-[2-(4-clorofenil)-5-metil]-tiazolil-acético. Se agita durante otros 15 minutos a temperatura ambiente. A continuación se añaden 4,4 ml de trietilamina y se añaden inmediatamente, gota a gota, 1,12 ml de oxiclورو de fósforo, de tal manera que la solución hierve moderadamente. Se calienta durante 30 minutos a reflujo.

La solución de la reacción se vierte en 200 ml de agua helada, se extrae con diclorometano y se seca. El disolvente se elimina por destilación y el residuo se recristaliza.

Rendimiento: 6,19 g (Δ 73 % de la teoría), Fp: 150°C.

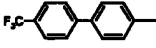
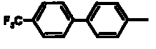
De manera análoga a la de los ejemplos (II-A-1) y (II-A-48) y de acuerdo con las indicaciones generales para la obtención se preparan los compuestos de la fórmula (II-A) siguientes.

247

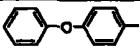
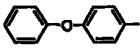
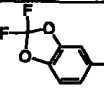
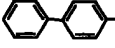


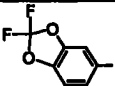
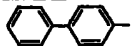
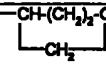
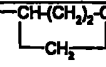
Ej n°	X	Y	D	A	B	R ^b	Fp°C	Isómero
II-A-2	CH ₃	4-Cl C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	121	β
II-A-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	120	β
II-A-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	201	-
II-A-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	132	-
II-A-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	139	-
II-A-7	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	124	β
II-A-8	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	106	-
II-A-9	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	164	-
II-A-10	CH ₃	C ₆ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	142	-
II-A-11	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	119	β
II-A-12	CH ₃	C ₆ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	143	β
II-A-13	CH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	acetate	β
II-A-14	CH ₃	2-Cl, 6-F-C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	acetate	β

248

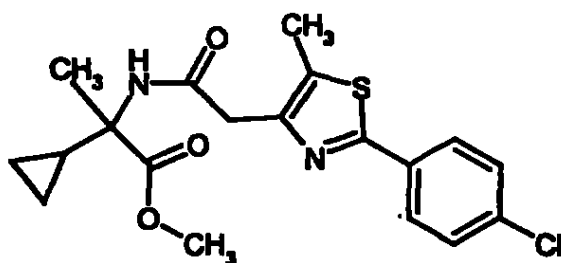
Ej n°	X	Y	D	A	B	R ⁸	Fp°C	Isómero
II-A-15	C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	114	β
II-A-16	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	128	β
II-A-17	C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	129	-
II-A-18	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	112	-
II-A-19	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	136	-
II-A-20	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	119	-
II-A-21	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	124	β
II-A-22	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	110	β
II-A-23	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	130	β
II-A-24	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	135	-
II-A-25	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	160	-
II-A-26	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	129	β
II-A-27	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	168	β
II-A-28	Br	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	127	-
II-A-29	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	163	-
II-A-30	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	160	-
II-A-31	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	144	-

245

Ej n°	X	Y	D	A	B	R ⁴	Fp°C	Isómero
II-A-32	i-C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	123	8
II-A-33	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	108	8
II-A-34	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	109	-
II-A-35	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	108	8
II-A-36	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	132	-
II-A-37	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	acete	-
II-A-38	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	118	8
II-A-39	CH ₃	4-Cl C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	177	-
II-A-40	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	157	8
II-A-41	CH ₃		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	137	8
II-A-42	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	115	8

Ej nº	X	Y	D	A	B	R ¹	Fp°C	Isómero
II-A-43	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	125	-
II-A-44	CH ₃		H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	146	-
II-A-45	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₄ -		H	C ₂ H ₅	acetite	-
II-A-46	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₂ -		H	C ₂ H ₅	acetite	-
II-A-47	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	1-C ₃ H ₇	H	H	C ₂ H ₅	acetite	-
II-A-48	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H		CH ₃	CH ₃		
II-A-49	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	1-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃		
II-A-50	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H			CH ₃		β
II-A-51	CH ₃	4-Cl C ₆ H ₄	H			CH ₃		α
II-A-52	Br	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	127	β
II-A-53	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃		β
II-A-54	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	136	β

Ejemplo n° II-A-48.

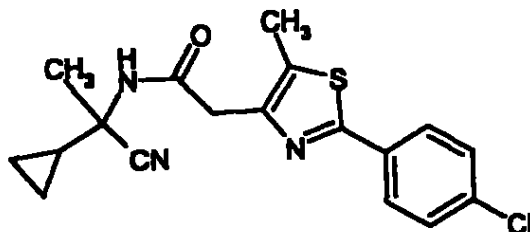


Se disponen 7,4 g (0,075 moles) de ácido sulfúrico concentrado y se añaden, gota a gota, 5,37 g del compuesto según el ejemplo XXI-A 1, en 30 ml de cloruro de metileno a una temperatura interna de 30 hasta 40°C. A continuación se continúa agitando durante 2 horas a 30 hasta 40°C. Se añaden, gota a gota, 11 ml de metanol absoluto, de tal manera que se establezca una temperatura interna de 40°C. Se continúa agitando durante 6 horas a 40 hasta 70°C.

La solución de la reacción se vierte sobre 0,08 kg de hielo. Se extrae con diclorometano, se lava con solución de NaHCO₃, se seca y el disolvente se elimina por destilación. A continuación se purifica el residuo mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice (diclorometano/acetato de etilo, 5:1).

Se obtienen 0,42 g (Δ 7 % de la teoría), Fp. 131°C.

Ejemplo XXI-A-1.



15

Se agitan durante 5 minutos 3,7 g de 2-amino-2-ciclopropil-propionitrilo en 60 ml de tetrahydrofurano absoluto y 4,92 ml de trietilamina. A continuación se añaden 8,03 g del ácido 5-metil-2-(4-cloro-fenil)-tiazolilacético y se agita durante 15 minutos a temperatura ambiente. Se añaden 6,6 ml de trietilamina e inmediatamente

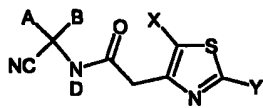
253
252

se añaden, gota a gota, 1,68 ml de oxiclورو de fósforo de tal manera que la solución hierva moderadamente.

Se agita durante 30 minutos a reflujo. El disolvente se elimina a continuación por destilación y el residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel
5 de sílice (n-hexano/acetato de etilo, 2:1).

Rendimiento: 5,37 g (49 % de la teoría), Fp. 114°C.

De manera análoga a la del ejemplo (XXI-A-1) y según las indicaciones generales para la obtención se preparan los compuestos de la fórmula (XXI-A) siguientes.

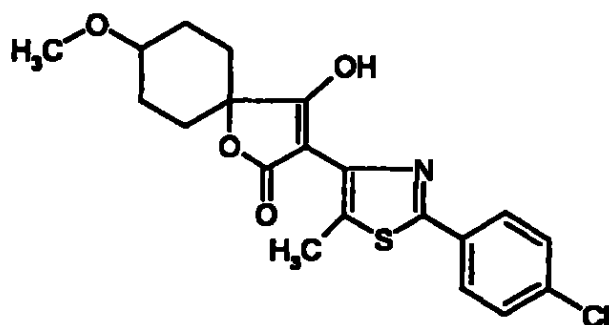


(XXI-A)

Ejemplo nº	X	Y	D	A	B	Fp°C
XXI-1-A -2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -		147
XXI-1-A -3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	1-C ₃ H ₇	CH ₃	134
XXI-1-A -4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-CH-(CH ₂) ₂ -CH-CH ₂ - CH ₂		151

~~255~~
259

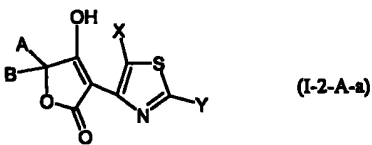
Ejemplo I-2-A-a-1.



Se añaden a 2,48 g (5,49 mmoles) del compuesto según el ejemplo III-1, en 10 ml de DMF anhidra, bajo refrigeración con hielo, 6,6 ml de solución 1 M de terc.-
5 butilato de potasio y se agita durante la noche a temperatura ambiente. El disolvente se elimina por destilación, el residuo se disuelve en agua, se acidifica lentamente con HCl concentrado, se separa mediante filtración por succión y se seca.

Rendimiento: 2 g (Δ 89 % de la teoría), Fp. 117-120°C).

De manera análoga a la del ejemplo (I-2-A-a-1) y de acuerdo con las
10 indicaciones generales para la obtención se preparan los compuestos de la fórmula (I-2-A-a) siguientes.



Ejemplo nº	X	Y	A	B	Fp°C
I-2-A-a-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	133-135
I-2-A-a-3	CH ₃	C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		
I-2-A-a-4	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	

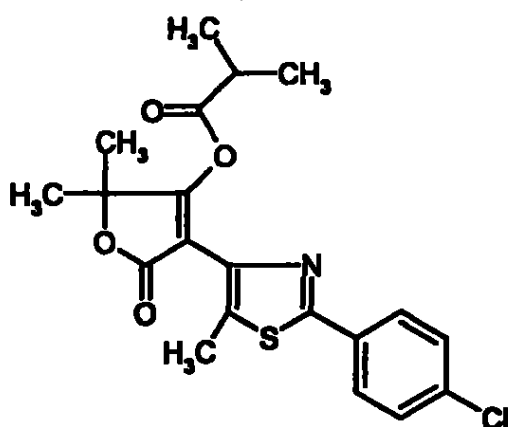
¹H-NMR (CDCl₃)

Ej -Nr I-2-A-a-3 δ = 1 45-2 25 (m, 8H), 2 90/3 00 (2s, 3H), 3 30/3 40 (2s, 3H), 3.25/3 50 (2m, 1H), 7 35-8 25 (m, 5H)

Ej -Nr I-2-A-a-4 δ = 1 60 (s, 6H), 2 95 (s, 3H), 7 45 (m, 3H), 7 80 (m, 2H)

256

Ejemplo I-2-A-b-1.

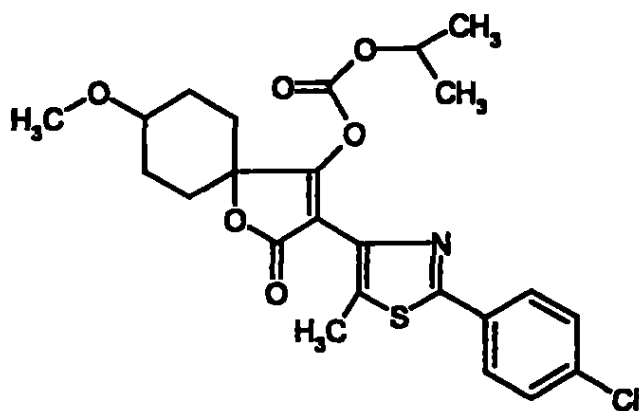


Se añaden a 0,7 g (2,1 mmoles) del compuesto según el ejemplo de obtención III-A-2, en diclorometano absoluto, y 0,232 g (2,3 mmoles) de trietilamina, a 0 hasta 5 10°C, 0,244 g (2,3 mmoles) de cloruro de isobutiroilo y se agita a temperatura ambiente durante 8 horas. La solución de la reacción se lava con ácido cítrico al 10 % y con solución de NaOH al 10 %. La fase orgánica se separa, se seca y se concentra por evaporación.

Se purifica mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice 10 (diclorometano/acetato de etilo, 20/1).

Rendimiento: 0,1 g Δ 11,8 % de la teoría, Fp. 95-98°C.

Ejemplo I-2-A-c-1.



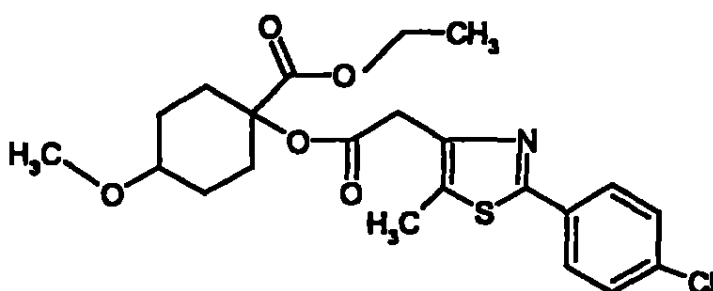
208
257

Se añade a 0,75 g (1,85 mmoles) según el ejemplo I-2-A-1 en diclorometano absoluto y 0,206 g (2 mmoles) de trietilamina, a 0 hasta 10°C, cloroformiato de isopropilo (0,249 g, 2 mmoles, 1 M en tolueno). Se agita durante 8 horas a temperatura ambiente. Se lava con solución de ácido cítrico al 10 % y con solución de NaOH al 10 %, se separa la fase orgánica, se seca y el disolvente se elimina por destilación.

Se purifica mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice (diclorometano/acetato de etilo, 20/1).

Rendimiento : 0,37 g Δ 40 % de la teoría, Fp. 140-145°C.

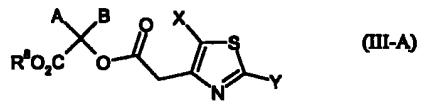
10 Ejemplo III-A-1.



Se agitan durante 6 horas a 140°C, 1,11 g (5,49 mmoles) del 4-metoxi-1-hidroxi-ciclohexano-1-carboxilato de etilo y 1,57 g (5,49 mmoles) del compuesto según el ejemplo XXVI-1, se refrigera y se expulsa el HCl gaseoso con argon.

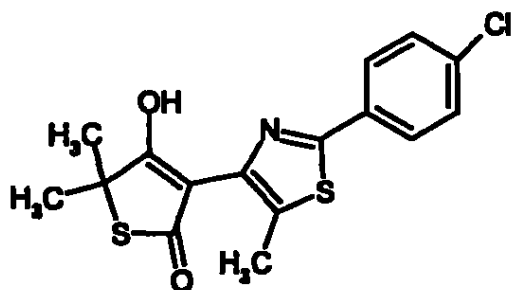
15 Rendimiento: 2,4 g (Δ 41,62 % de la teoría), logP (ácido) 4,54 (HPLC; acetonitrilo).

De manera análoga a la del ejemplo (III-A-1) y de acuerdo con las indicaciones generales para la obtención se preparan también los compuestos de la fórmula (III-A) siguientes



Ejemplo n°	X	Y	A	B	R ¹	Fp °C
III-A-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	log P (pH2) 4.53
III-A-3	CH ₃	C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	
III-A-4	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	

Ejemplo I-3-A-a-1.

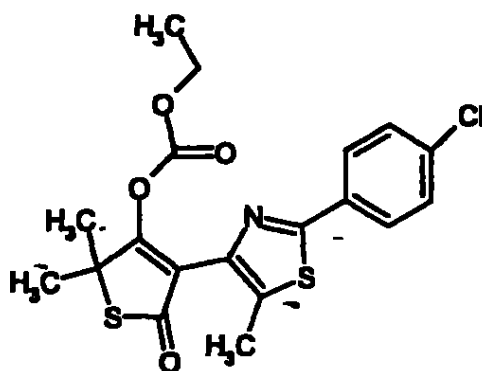


Se disponen 15 g (20 mmoles) del compuesto según el ejemplo (IV-A-1) en 22 ml de ácido trifluoracético (TFA) y 51 ml de tolueno y se calienta durante la noche a reflujo. El disolvente y el TFA se eliminan por destilación, el residuo se recoge en 200 ml de agua y 200 ml de metil-terc.-butiléter. La fase orgánica se extrae de manera alcalina y la fase acuosa se acidifica, se extrae con diclorometano, se seca y el disolvente se elimina por destilación.

Se purifica mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice (diclorometano/acetato de etilo, 10:1 → 5:1).

Rendimiento: 1,6 g (23 % de la teoría), Fp. 132-135°C.

Ejemplo I-3-A-c-1.



Se disponen 500 mg (1,4 mmoles) del compuesto según el ejemplo (I-3-A-a-1) en 5 ml de diclorometano absoluto, se combinan con 0,29 ml (2,1 mmoles, 1,5 equivalentes) de trietilamina y se añaden, bajo refrigeración con hielo, 0,2 g (1,9 mmoles, 1,3 equivalentes) de cloroformiato de etilo.

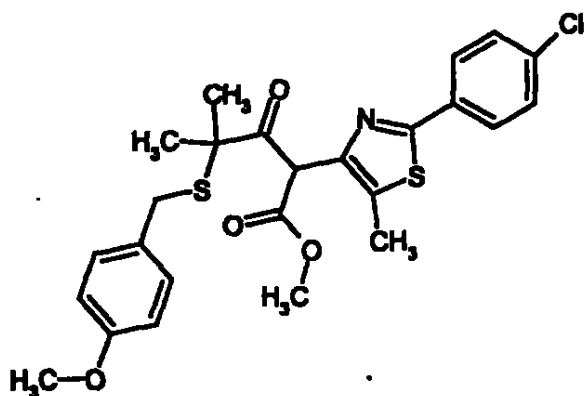
261
760

Se agita durante 2 horas a temperatura ambiente. Se lava con ácido cítrico al 10 %, se extrae con diclorometano, se lava con NaOH 1 N, se extrae con diclorometano, se seca y el disolvente se elimina por destilación.

Rendimiento: 0,55 g (93 % de la teoría) aceite.

- 5 ¹H-NMR (d₆ DMSO, 400 MHz): δ= 0,93 (t, 3H, CH₃-CH₂), 1,75 (s, 6H, 2 CH₃-C), 2,37 (s, 3H, CH₃-C arom.), 3,98 (q, 2H, CH₃-CH₂), 7,55 (d, 2H, 2 CH arom.), 7,87 (d, 2H, 2 CH arom.) ppm.

Ejemplo IV-A-1.



- 10 Se disponen 4,8 g (20,0 mmoles) del ácido 2-(4-metoxi-benciltio)-2-metil-propiónico en 40 ml de tolueno anhidro y una gota de DMF y se añaden 7,2 g (60 mmoles, 5 ml) de cloruro de tionilo. Se agita durante 5 minutos a temperatura ambiente, a continuación a 100°C, hasta que concluya el desprendimiento gaseoso. El disolvente se elimina por destilación y el residuo se recoge en 10 ml de
- 15 tetrahidrofurano anhidro (solución A).

- Se disponen 17,1 ml de diisopropilamida de litio en 40 ml de tetrahidrofurano anhidro a 0°C y se añaden, gota a gota, 10,1 g (32,7 mmoles) del 4-[5-metil-2-(4-cloro-fenil)]-tiazolil-acetato de metilo en 10 ml de tetrahidrofurano anhidro a 0°C y se continúa agitando durante 30 minutos. A continuación se añade, gota a gota, la
- 20 solución A a 0°C y se agita durante 1 hora mas a temperatura ambiente. A continuación se combina la mezcla de la reacción con 100 ml de MTB-éter y algunas gotas de agua y se lava 2 x con 100 ml cada vez de solución al 10 % de NH₄Cl, la

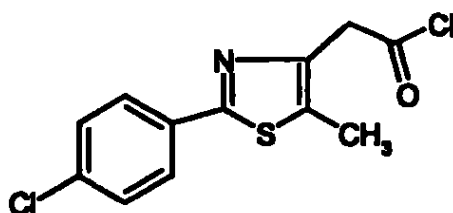
262
261

fase orgánica se seca y el disolvente se elimina por destilación. El producto en bruto se hace reaccionar sin purificación adicional.

Rendimiento: 15,2 g (100 % de la teoría).

¹H-NMR (DMSO, 400 MHz): δ = 1,43 (s, 3H, CH₃-C alif.), 1,50 (s, 3H, CH₃-C alif.), 2,40 (s, 3H, CH₃-C heteroátom.), 3,31 (s, 2H, CH₂), 3,61 (s, 3H, CH₃-OCO), 3,82 (s, 3H, CH₃-O) ppm.

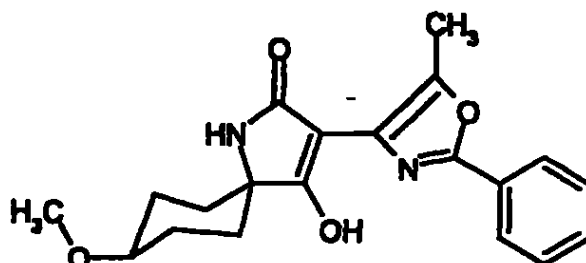
Ejemplo XVI-1.



Se disponen 3 g (11,21 mmoles) del ácido 4-[2-(4-clorofenil)-5-metil]-tiazol-
acético en 50 ml de diclorometano absoluto. Se añaden lentamente, gota a gota, bajo
refrigeración con hielo, 2,13 g (16,81 mmoles) de cloruro de oxalilo, se agita durante
la noche a temperatura ambiente y a continuación se calienta durante 2 horas a
reflujo y el disolvente se elimina por destilación.

Rendimiento: 3,19 g (96 % de la teoría).

Ejemplo I-1-B-a-1.

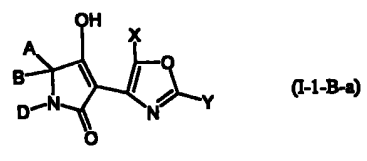


Se añaden gota a gota a 2,41 g (0,020 moles) de terc.-butilato de potasio en
17 ml de dimetilformamida anhidra (DMF), a 20°C, 3,59 g del compuesto según el
ejemplo de obtención II-B-1 en 7 ml de DMF anhidra y se agita a 40°C durante 1
hora.

La solución de la reacción se introduce bajo agitación en 100 ml de agua helada y se acidifica con ácido clorhídrico a 0 hasta 10°C. El precipitado se separa mediante filtración por succión y se cromatografía con cloruro de metileno/acetona 5:1 sobre gel de sílice.

- 5 Rendimiento: 1,2 g (36 % de la teoría), Fp >240°C.

De manera análoga a la del ejemplo (I-1-B-a-1) y de acuerdo con las indicaciones generales para la obtención se preparan los compuestos de la fórmula (I-1-B-a) siguientes.

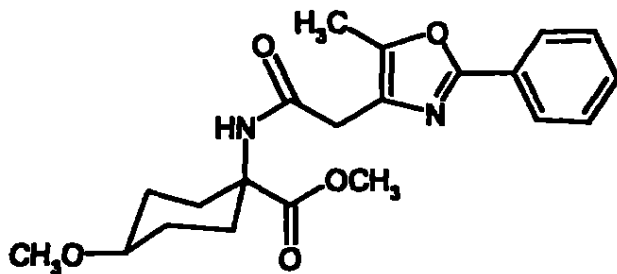


Ejemplo n°	X	Y	D	A	B	Fp°C	Isómero
I-1-B-a-2	CH ₃	C ₆ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	187	-
I-1-B-a-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		279	B

192

265
269

Ejemplo II-B-1.



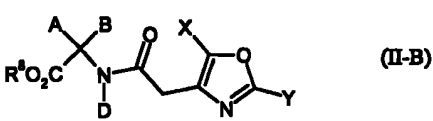
Se disponen 4,56 g (20 mmoles) del hidrocloreto del 1-amino-4-metoxi-
ciclohexanocarboxilato de metilo en 60 ml de THF absoluto, se combinan con 6 ml
5 de trietilamina y se agita durante 5 minutos. Se añaden 3,27 g del ácido 4-(2-fenil-5-
metil)-oxazolil-acético y se agita a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se
añaden 3,3 ml de trietilamina y se añaden, gota a gota, 0,84 ml de oxiclورو de
fósforo, de tal manera que la solución hierva moderadamente.

Se agita durante 30 minutos a reflujo.

10 El disolvente se elimina por destilación y el precipitado se purifica mediante
cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano/acetato de etilo, 3:1).

Rendimiento: 3,59 g (61 % de la teoría), Fp 125°C.

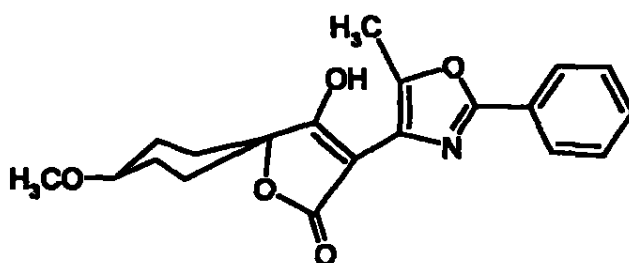
De manera análoga a la del ejemplo (II-B-1) y de acuerdo con las
indicaciones generales para la obtención se preparan los compuestos de la fórmula
15 (II-B) siguientes.



Ej	D°	X	Y	D	A	B	R ⁸	Fp°C	Isómero
II-B-2		CH ₃	C ₆ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	101	-
II-B-3		CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	95	B

26

Ejemplo I-2-B-a-1.

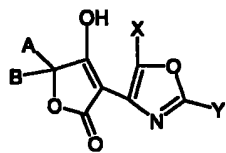


Se calentaron durante la noche, a 140°C, sin disolvente, 1,01 g (5 mmoles) del 4-metoxi-1-hidroxi-ciclohexano-1-carboxilato de etilo y 1,095 g (5 mmoles) del 5 cloruro de 2-fenil-4-metil-isoxazol-3-acetilo y a continuación se desgasificó momentáneamente en vacío. El producto en bruto obtenido se disolvió en 10 ml de DMF. Se dosificaron 6 ml de solución 1 M de KOtBu en DMF en el transcurso de 10 minutos, se agitó a temperatura ambiente durante la noche, se concentró a sequedad en el evaporador rotativo, el residuo se disolvió en agua, se extrajo 1 x con acetato de etilo para eliminar las impurezas, se dosificaron, lentamente, 10 ml de ácido clorhídrico 1N (hasta acidez) y el producto precipitado se separó mediante filtración por succión. La purificación se llevó a cabo mediante HPLC preparativa (acetonitrilo/agua sobre RP 18):

Rendimiento: 0,33 g (19 % de la teoría), Fp. 65°C.

15 ¹H-NMR MHz (CDCl₃): δ = 1,60-2,30 (m, 8H), 2,85 (s, 3H), 3,30/3,40 (2s, 3H), 3,30/3,60 (2 m, 1H), 7,40-8,00 (m, 5H).

De manera análoga a la del ejemplo (I-2-b-a-1) y de acuerdo con las indicaciones generales para la obtención se prepararon los compuestos de la fórmula (I-2-B-a) siguientes.



(I-2-B-a)

Ejemplo n°	X	Y	A	B	Fp°C
I-2-B-a-2	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	log P (pH2) 3,43

63

Ejemplos de aplicación:

Ejemplo A

Ensayo con Meloidogyne

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

5 **Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

10 Se rellenan recipientes con arena, solución del producto activo, suspensión de huevos-larvas de Meloidogyne incógnita y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantucas se desarrollan. En las raíces se desarrollan vesículas.

Al cabo del tiempo deseado se determina en % el efecto nematocida por medio de la formación de vesículas. En este caso 100 % significa que no se han encontrado vesículas; 0 % significa que el número de las vesículas en las plantas tratadas corresponde al de los controles no tratados.

En este ensayo muestran una buena actividad, por ejemplo, los compuestos siguientes de los ejemplos de obtención: I-2-a-1 y I-2-a-2.

20 **Ejemplo B**

Ensayo con Myzus

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

25 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Se tratan hojas de col (Brassica oleracea), que están fuertemente atacadas por el piojo de la hoja del duraznero (Myzus persicae), mediante inmersión en la

preparación del producto activo de la concentración deseada.

Al cabo del tiempo deseada se determina la destrucción en porcentaje. En este caso 100 % significa que se destruyeron todos los piojos de la hoja; 0 % significa que no se destruyó ningún piojo de la hoja.

- 5 En este ensayo. muestran una buena actividad, por ejemplo, los compuestos siguientes de los ejemplos de obtención: I-2-a-1, I-1-a-5, I-1-a-6 y I-1-a-8.

Ejemplo C

Ensayo con larvas de Phaeton

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

- 10 **Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

- 15 Se tratan por inmersión hojas de col (*Brassica oleracea*) en la preparación de producto activo de la concentración deseada y se cubren con larvas del escarabajo de la hoja del rábano rústico picante (*Phaeton cochleariae*), mientras las hojas estén aún húmedas.

- 20 Al cabo del tiempo deseado se determina en % el grado de muertes. En este caso 100 % significa que todas las larvas del escarabajo fueron destruidas, 0 % significa que no fue destruida ninguna larva del escarabajo.

En este ensayo muestran una buena actividad, por ejemplo, los compuestos siguientes de los ejemplos de obtención: I-2-a-1, I-2-a-2, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-2, I-1-a-1, I-1-c-1 y I-1-a-8.

- 25 **Ejemplo D.**

Ensayo con Spodoptera Frugiperda

Disolvente: 30 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

271
270

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

- 5 Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*) mediante inmersión en la preparación del producto activo de la concentración deseada y se cubren con orugas del cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*), mientras que las hojas estén aún húmedas.

- 10 Al cabo del tiempo deseado se determina el grado de destrucción en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

En este ensayo muestran una buena actividad, por ejemplo, los compuestos siguientes de los ejemplos de obtención: I-2-a-1, I-1-a-4, I-1-a-5, I-1-a-6, I-1-a-2, I-1-a-1 y I-1-c-1.

15 **Ejemplo E**

Ensayo con *Tetranychus* (OP-resistente/tratamiento por inmersión)

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

- 20 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

- 25 Se sumergen plantas de judías (*Phaseolus vulgaris*), que están fuertemente atacadas por todos los estados del desarrollo del ácaro de la arañuela roja común (*Tetranychus urticae*), en una preparación del producto activo de la concentración deseada.

Al cabo del tiempo deseado se determina en % el grado de muertes. En este caso significan 100 % que se mataron todos los ácaros de la arañuela; 0 % significa que no se mató ningún ácaro de la arañuela.

292
291

En este ensayo muestran una buena actividad, por ejemplo, los compuestos siguientes de los ejemplos de obtención: I-2-a-2, I-1-a-4, I-1-a-5 y I-1-a-6.

Ejemplo F.

Ensayo de post-brote.

- 5 **Disolvente:** 5 Partes en peso de acetona.
Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la
10 concentración deseada.

Con la preparación del producto activo se pulverizan plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm, de tal manera que, se apliquen respectivamente las cantidades de producto activo deseadas por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal manera que se apliquen, en 1000 litros de
15 agua/ha las cantidades deseadas en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

- 0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).
20 100 % = destrucción total.

Ejemplo G.

Ensayo pre-brote.

- Disolvente:** 5 Partes en peso de acetona.
Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.
25 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

243
272

Se siembran en terreno normal semillas de las plantas de ensayo. Al cabo de 24 horas, aproximadamente, se riega el suelo con la preparación del producto activo. En este caso se mantiene convenientemente constante la cantidad de agua por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal manera que se apliquen, en 1000 litros de agua/ha las cantidades deseadas en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

- 10 0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).
- 100 % = destrucción total.

Pre-brote	g ai/ha	Remola-cha azucarera	Colza	Alopecurus	Avena fatua	Lolium	Setaria	Matricaria
Ejemplo I-2-a-1	125	0	0	90	100	100	100	100

Post-brote	g ai/ha	Colza	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Setaria	Amaranthus	Chenopodium
Ejemplo I-2-a-1	250	20	80	95	100	100	70	70

Pre-brote	g ai/ha	Remola-cha azucarera	Colza	Avena fatua	Bromus	Lolium	Setaria
Ejemplo I-2-a-2	250	0	0	90	90	100	100

2

27x
273

Post-brote	g ai/ha	Colza	Soja	Avena fatua	Digitaria	Echinochloa	Setaria
Ejemplo I-2-a-2	250	0	0	90	90	100	95

Post-brote	g ai/ha	Alopecurus	Echinochloa	Amaranthus
Ejemplo I-1-a-5	250	80	100	90

Post-brote	g ai/ha	Remolacha azucarera	Alopecurus	Avena fatua	Digitaria	Echinochloa
Ejemplo I-1-a-6	125	0	90	90	95	90

Post-brote	g ai/ha	Alopecurus	Echinochloa	Setaria	Amaranthus
Ejemplo I-1-a-2	250	70	90	95	90

5

Post-brote	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Amaranthus	Sinapis
Ejemplo I-1-a-1	250	80	80	95	70	80

Post-brote	g ai/ha	Arroz	Avena fatua	Digitaria	Echinochloa	Stellaria
Ejemplo I-1-a-3	250	10	100	100	100	90

279 295

Post-brote	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Setaria
Ejemplo I-1-c-1	250	80	95	95	90

Post-brote	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Setaria	Abutilon	Amaranthus
Ejemplo I-1-a-4	250	95	100	100	100	80	95
Ejemplo I-1-b-1	250	95	100	100	100	80	80

Ejemplo H

- 5 **Ensayo de concentración límite/insectos del terreno. Tratamiento de plantas transgénicas.**

Insecto de ensayo: *Diabrotica balteata* – larvas en el terreno

Disolvente: 7 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

- 10 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

- 15 Se riega sobre el terreno la preparación del producto activo. En este caso prácticamente no juega ningún papel la concentración del producto activo en la preparación, siendo únicamente decisiva la cantidad de producto activo por unidad de volumen de terreno, que se indica en ppm (mg/l). Se rellenan con el terreno tiestos de 0,25 litros y se dejan reposar a 20°C.

276
275

- Inmediatamente después de la carga se disponen, en cada tiesto, 5 granos de maíz pregerminados de la variedad YIELD GUARD (marca registrada de Monsanto Comp., USA). Al cabo de 2 días se disponen los insectos de ensayo correspondientes en los terrenos tratados. Al cabo de otros 7 días se determina el grado de actividad del producto activo por conteo de las plantas de maíz desarrolladas (1 planta = 20 % de actividad).

Ejemplo I

Ensayo con *Heliothis virescens* - tratamiento de plantas transgénicas

- Disolvente:** 7 Partes en peso de acetona
- 10 **Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

- 15 Se tratan brotes de soja (*Glycine max*) de la variedad Roundup Ready (marca registrada de Monsanto Comp. USA), mediante inmersión, en la preparación de producto activo de la concentración deseadas y se cubren con orugas del capullo del tabaco *Heliothis virescens*, mientras que las hojas estén húmedas.

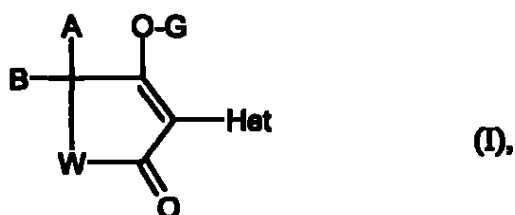
Al cabo del tiempo deseado se determina la destrucción de los insectos.

- 20 Se hace constar que , con relación a esta fecha, el mejor método conocido por la solicitante para llevar a la práctica la citada invención, es el que resulta claro de la presente descripción de la invención.

Habiéndose descrito la invención como antecede se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes:

REIVINDICACIONES

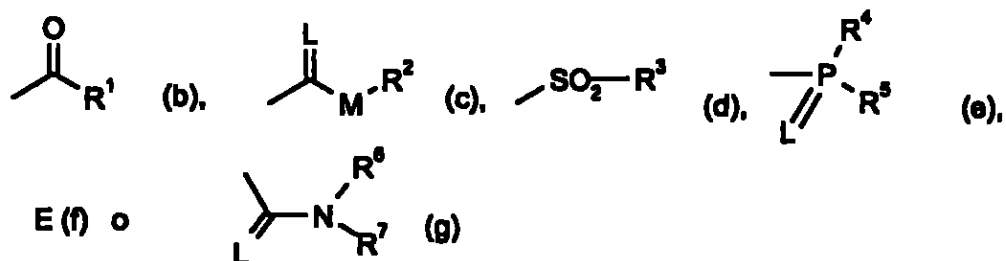
1.- Compuestos de la fórmula (I)



en la que

- 5 W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾,
- Het significa tiazolilo, oxazolilo o pirazolilo substituidos respectivamente en caso
 dado,
- A significa hidrógeno, significa alquilo, alquenilo, alcoxialquilo, polialcoxial-
 quilo, alquiltioalquilo substituidos respectivamente en caso dado por
10 halógeno, cicloalquilo saturado o insaturado, substituido en caso dado, en el
 cual está reemplazado en caso dado al menos un átomo del anillo por un
 heteroátomo, o arilo, arilalquilo o hetarilo substituidos respectivamente en
 caso dado por halógeno, por alquilo, por halógenoalquilo, por alcoxi, por
 halógenoalcoxi, por ciano o por nitro,
- 15 B significa hidrógeno, alquilo o alcoxialquilo, o
 A y B junto con el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan un ciclo
 saturado o insaturado, que contiene al menos un heteroátomo, insubstituido o
 substituido,
- D significa hidrógeno o significa un resto substituido en caso dado de la serie
20 formada por alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxialquilo, polialcoxialquilo,
 alquiltioalquilo, cicloalquilo saturado o insaturado, en el cual están
 reemplazados en caso dado uno o varios miembros del anillo por
 heteroátomos, arilalquilo, arilo, hetarilalquilo o hetarilo o
 A y D junto con los átomos, con los que están enlazados, significan un ciclo

G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos



E significa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,

M significa oxígeno o azufre,

10

15

 $\mathbb{R}^3$

20

 $R^6 \vee R^7$

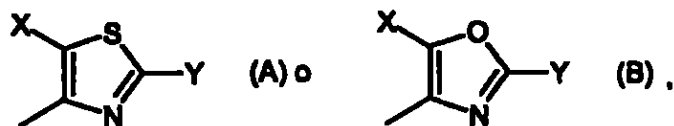
278 328

cicloalquilo, alquenilo, alcoxi, alcoxialquilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significan fenilo substituido en caso dado, significan bencilo substituido en caso dado o junto con el átomo de N, con el que están enlazados, significan un ciclo interrumpido en caso dado por oxígeno o por azufre.

5

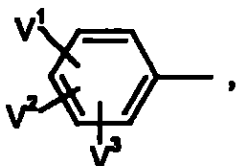
2.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Het significa

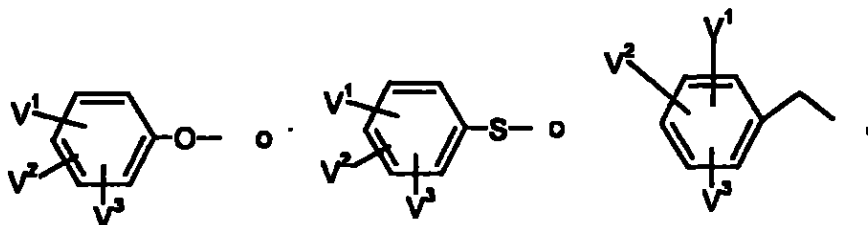


X significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, nitro o ciano,

Y significa halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfoxinilo con 1 a 6 átomos de carbono o significa el grupo



o en el caso en que Het = tiazolilo ((I-1-A) hasta (I-3-A)), significa también



V1 significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 12 átomos de carbono, alcoxi

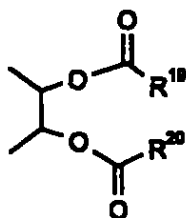
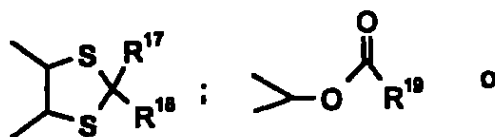
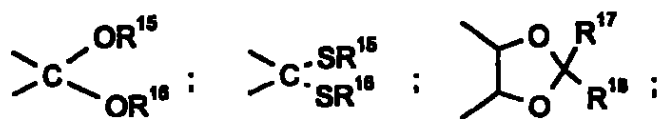
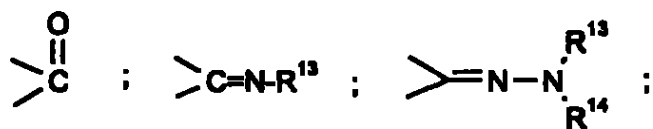
- con 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, nitro, ciano, fenoxi o significa fenilo, fenoxi,
- 5 fenoxi-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, fenil-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, feniltio-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o fenil-alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado una o varias veces por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por
- 10 halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por nitro o por ciano,
- V^2 y V^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o
- 15 V^1 y V^2 significan junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, un ciclo con 5 o 6 miembros saturado o insaturado, substituido en caso dado por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógeno, en el cual pueden estar reemplazados en caso dado de 1 a 3 átomos de carbono por oxígeno, por azufre o por nitrógeno,
- 20 W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾,
- A significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 12 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono- alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, poli-alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 10 átomos de
- 25 carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, en el cual están reemplazados en caso dado uno o dos miembros del anillo no directamente

- contiguos por oxígeno y/o por azufre o significa arilo con 6 o con 10 átomos de carbono, hetarilo con 5 a 6 átomos en el anillo o arilo con 6 o 10 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por ciano o por nitro,
- 5 B significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o
- 10 A, B y el átomo de carbono con el que están enlazados significan cicloalquilo con 3 a 10 átomos de carbono saturado o cicloalquilo con 5 a 10 átomos de carbono insaturado, estando reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre y que está substituido en caso dado una o dos veces por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono, por halógeno o por fenilo o
- 15 A, B y el átomo de carbono con el que están enlazados significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, que está substituido por un grupo alquilendiilo que contiene en caso 1 átomo de oxígeno o de azufre, o por un grupo alquilendioxilo o por un grupo alquilenditionilo, que forma con el átomo de carbono, con el que está enlazado, otro anillo con 5 o 6 miembros que puede estar substituido, en caso dado, de una a cuatro veces, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o
- 20 A, B y el átomo de carbono con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono o cicloalquenilo con 5 a 8 átomos de carbono, en el cual dos substituyentes junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, significan alcanodiilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquenodiilo con 2 a 6 átomos de carbono o alcanodiendiilo con 4 a 6 átomos de carbono
- 25

- substituidos respectivamente en caso dado por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono o por halógeno, estando reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre,
- 5 D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 12 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 8 átomos de carbono, alquinilo con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 10 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, poli-alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 10 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o por ciano, significa cicloalquilo
- 10 con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre o significa fenilo, hetarilo con 5 o 6 átomos en el anillo, fenil-alquilo con 1 a 6
- 15 átomos de carbono o hetaril-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono con 5 o 6 átomos en el anillo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por ciano o por nitro o
- 20 A y D significan conjuntamente alcanodiilo con 3 átomos de carbono o alquenodiilo con 3 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado, estando reemplazado en caso dado un grupo metileno por un grupo carbonilo, por oxígeno o por azufre y
- entrando en consideración respectivamente como substituyentes:
- 25 halógeno, hidroxí, mercapto o alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono, fenilo o benciloxi substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, u otro agrupamiento alcanodiilo con 3 a 6 átomos de carbono, agrupamiento alquenodiilo con 3 a 6 átomos de

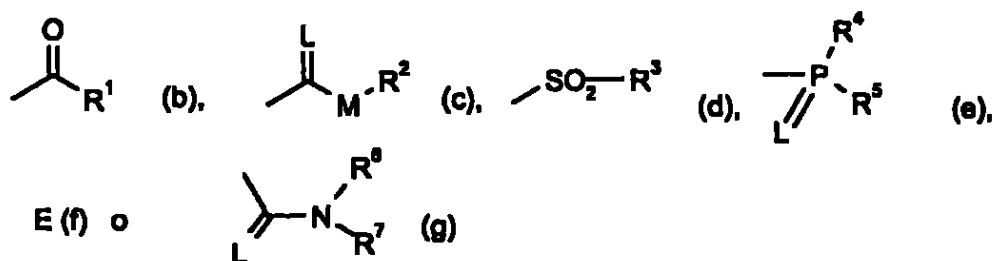
5 carbono o un agrupamiento butadienilo, que está substituido en caso dado por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o en el cual en caso dado dos substituyentes contiguos significan, junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, otro ciclo saturado o insaturado con 5 o 6 átomos en el anillo (en el caso de los compuestos de la fórmula (I-1-A) hasta (I-1-B), A y D significan entonces junto con los átomos, con los que están enlazados, por ejemplo, los grupos citados a continuación AD-1 hasta AD-10), que puede contener oxígeno o azufre, o en el que está contenido en caso dado uno de los grupos siguientes

10



G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos

28X
283



en los cuales

- E significa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,
- L significa oxígeno o azufre y
- 5 M significa oxígeno o azufre,
- R¹ significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alquénilo con 2 a 20 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, poli-alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 1 a 8 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o significa
- 10 cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, en el cual están reemplazados en caso dado uno o varios miembros del anillo no directamente contiguos por oxígeno y/o por azufre,
- 15 significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por ciano, por nitro, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono,
- 20 significa fenil-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno, por nitro, por ciano, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significa hetarilo con 5 o 6 miembros substituido en caso dado por halógeno,

285
284

- por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa fenoxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno o por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o
- 5 significa hetariloxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, con 5 o 6 miembros, substituido en caso dado por halógeno, por amino, o por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,
- R^2 significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de
- 10 carbono, poli-alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un átomo del
- 15 anillo por oxígeno, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por ciano, por nitro, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,
- 20 R^3 significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por ciano o por nitro,
- 25 R^4 y R^5 significan, independientemente entre sí, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alquilamino con 1 a 8 átomos de carbono, di-(alquilo con 1 a 8 átomos de carbono)amino, alquiltio con 1 a 8 átomos de carbono, alqueniltio con 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil-tio con 3 a 7 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por

286
285

- halógeno o significan fenilo, fenoxi o feniltio substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por nitro, por ciano, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- 5
- R^6 y R^7 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, significan alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 1 a 8 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significan fenilo substituido en caso dado por halógeno, por halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, por alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, significan bencilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono o en conjunto significan un resto alquilenos con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está remplazado en caso dado un átomo de carbono por oxígeno o por azufre,
- 10
- 15
- 20 R^{13} significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre, o significa fenilo, fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o fenil-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4
- 25

281
286

átomos de carbono, por nitro o por ciano,

R¹⁴ significa hidrógeno o alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o

R¹³ y R¹⁴ significan en conjunto alcanodiilo con 4 a 6 átomos de carbono,

R¹³ y R¹⁶ son iguales o diferentes y significan alquilo con 1 a 6 átomos de
5 carbono o

R¹⁵ y R¹⁶ significan conjuntamente un resto alcanodiilo con 2 a 4 átomos de
carbono, que está substituido en caso dado por alquilo con 1 a 6 átomos de
carbono, por halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono o por fenilo
substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6 átomos de
10 carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a
6 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por
nitro o por ciano,

R¹⁷ y R¹⁸ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, significan alquilo
con 1 a 8 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno o
15 significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 6
átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por
halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4
átomos de carbono, por nitro o por ciano, o

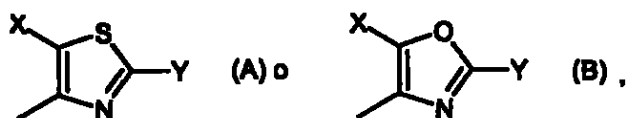
R¹⁷ y R¹⁸ significan junto con el átomo de carbono, con el que están enlazados,
20 un grupo carbonilo o significan cicloalquilo con 5 a 7 átomos de carbono
substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de
carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está
reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre,

R¹⁹ y R²⁰ significan, independientemente entre sí, alquilo con 1 a 10 átomos de
25 carbono, alquenilo con 2 a 10 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 10 átomos de
carbono, alquilamino con 1 a 10 átomos de carbono, alquenilamino con 3 a 10
átomos de carbono, di-(alquilo con 1 a 10 átomos de carbono)amino o di-
(alquenilo con 3 a 10 átomos de carbono)amino.

3.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

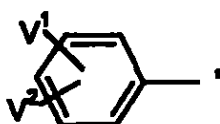
285
287

Het significa

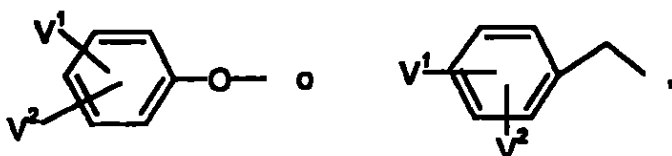


X significa hidrógeno, cloro, bromo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, nitro o ciano,

5 Y significa cloro, bromo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o significa el grupo



10 o en el caso en que Het = tiazolilo ((I-1-A) hasta (I-3-A)) significa también



V¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, nitro, ciano,
 15 fenoxi o significa fenilo, fenoxi, fenoxi-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono, fenil-alcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, feniltio-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono o fenil-alquiltio con 1 a 2 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado una o dos veces por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos
 20 de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, por nitro o por ciano,

288
288

- V²** significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono o
- V¹ y V²** significan junto con los átomos de carbono, con los que están
- 5 enlazados, un ciclo con 5 o 6 miembros substituido en caso dado por flúor o por metilo, en el cual pueden estar reemplazados en caso dado 1 o 2 átomos de carbono por oxígeno,
- W** significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾,
- A** significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alcoxi
- 10 con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, significan cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por
- 15 azufre o significa fenilo o fenil-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,
- 20 **B** significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o
- A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 7 átomos de carbono saturado, estando reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre y que está substituido en caso**
- 25 **dado una o dos veces por alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, por cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, por flúor, por cloro o por fenilo,**
- A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, que está substituido en caso dado por un grupo**

290
289

alquilendiilo, que contiene en caso dado un átomo de oxígeno o de azufre, o por un grupo alquilendioxilo o por un grupo alquilenditionilo, que forma con el átomo de carbono, con el que está enlazado, otro anillo de 5 o 6 miembros que puede estar substituido en caso dado de una a tres veces por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, o

5 A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono o cicloalquenilo con 5 a 6 átomos de carbono, en el cual dos substituyentes significan, junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, alcanodiilo con 2 a 4 átomos de carbono, alquenodiilo con 2 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por alquilo con 1 a 5 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 5 átomos de carbono, por flúor, por cloro o por bromo, estando reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre o significan butadiendiilo,

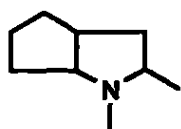
10 D significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 4 átomos de carbono o alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, significa cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre o significa fenilo o fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono o

25 A y D significan conjuntamente alcanodiilo con 3 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado, en el cual puede estar reemplazado en caso dado un grupo metileno por un grupo carbonilo, por oxígeno o por azufre, entrando en

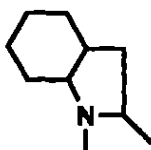
291
290

consideración como sustituyentes hidroxí, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o

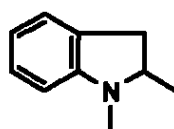
A y D significan junto con los átomos, con los que están enlazados, uno de los grupos AD-1 hasta AD-10:



AD-1

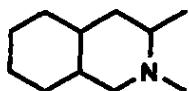


AD-2

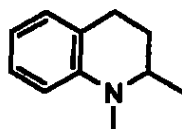


AD-3

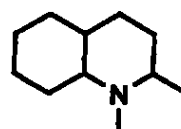
5



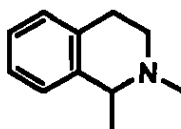
AD-4



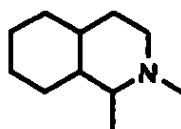
AD-5



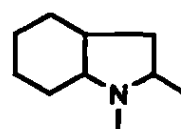
AD-6



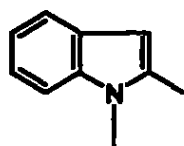
AD-7



AD-8

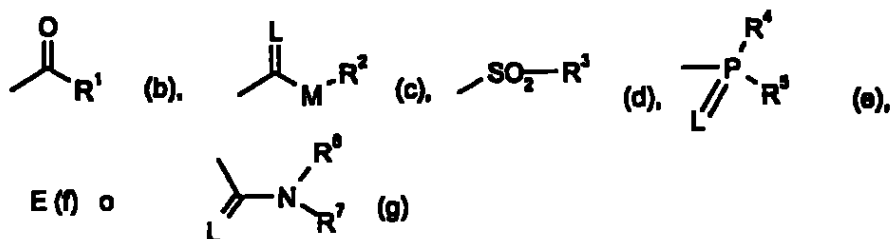


AD-9



AD-10

G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos



10

en los cuales

292
291

- E significa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,
- L significa oxígeno o azufre y
- M significa oxígeno o azufre,
- R¹ significa alquilo con 1 a 16 átomos de carbono, alqueno con 2 a 16 átomos
- 5 de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro o significan cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por alquilo con 1 a 5 átomos de carbono o por alcoxi con
- 10 1 a 5 átomos de carbono, en el cual están reemplazados en caso dado uno o dos miembros del anillo, no directamente contiguos, por oxígeno y/o por azufre,
- significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por nitro, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4
- 15 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- significa fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por
- 20 alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono,
- significa pirazolilo, tiazolilo, piridilo, pirimidilo, furanilo o tienilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por trifluormetilo o por alcoxi con 1
- 25 a 2 átomos de carbono,
- R² significa alquilo con 1 a 16 átomos de carbono, alqueno con 2 a 16 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor,
- significa cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono substituido en caso dado

293
292

- por flúor, por cloro, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o
- significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por nitro, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono,
- 5 R^3 significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor o significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por ciano o por nitro,
- 10 R^4 significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino con 1 a 6 átomos de carbono, di-(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)amino, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono-alqueniltio con 3 a 4 átomos de carbono, cicloalquiltio con 3 a 6 átomos de carbono o
- 15 *significa fenilo, fenoxi o feniltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por nitro, por ciano, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono o por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono,*
- 20 R^5 significa alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono o alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono,
- R^6 significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa
- 25

294
293

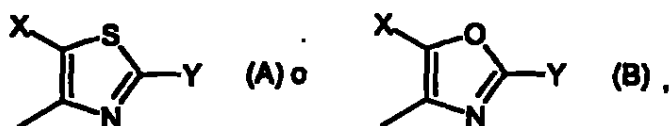
bencilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

5 R^7 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, o

R^6 y R^7 significan conjuntamente un resto alquileno con 4 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por metilo o por etilo, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre.

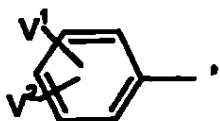
4.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

10 Het significa



X significa hidrógeno, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo o iso-butilo,

15 Y significa metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc.-butilo, trifluórmtilo o significa el grupo



o en el caso en que Het = tiazolilo ((I-1-A) hasta (I-3-A)) significa también



20 V^1 significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, trifluórmtilo, trifluórmtoxi, nitro, ciano, fenoxi o fenilo substituido en caso dado una o dos veces por flúor, por cloro, por metilo, por metoxi, por

295
299

trifluórmétilo o por trifluórmétoxi,

V² significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, metoxi, etoxi, trifluórmétilo o trifluórmétoxi, o

V¹ y V² significan conjuntamente -O-CH₂-O-, -O-CF₂-O- o -O-CF₂-CF₂-O-,

5 W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾,

A significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por flúor, por metilo, por etilo o
10 por metoxi, en el cual está reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n-propilo, por iso-propilo, por terc.-butilo, por metoxi o por etoxi, por trifluórmétilo, por trifluórmétoxi, por ciano o por nitro,

15 B significa hidrógeno, metilo o etilo o

A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono saturado, en el cual está reemplazado en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre y que está substituido en caso dado una o dos veces por metilo, por etilo, por propilo, por isopropilo, por
20 butilo, por iso-butilo, por sec.-butilo, por terc.-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por propoxi, por iso-propoxi, por butoxi o por iso-butoxi o

A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 6 átomos de carbono, que está substituido en caso dado por un grupo alquilendioxilo, substituido en caso dado una o dos veces por metilo o por
25 etilo, que forma con el átomo de carbono, con el que está enlazado, otro anillo de 5 o 6 miembros o

A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono o cicloalquénilo con 5 a 6 átomos de carbono, significando dos substituyentes junto con los átomos de carbono, con los que

296
295

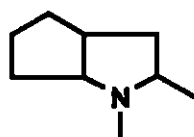
están enlazados, alcanodiilo con 2 a 4 átomos de carbono o alquendiilo con 2 a 4 átomos de carbono, estando reemplazados respectivamente en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre,

- D significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alqueniilo con 3 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 2 a 3 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 2 a 3 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por oxígeno o por azufre o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n-propilo, por iso-propilo, por metoxi, por etoxi, por trifluórmétilo o por trifluórmétoxi,

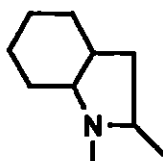
o

- A y D significan conjuntamente alcanodiilo con 3 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado, estando reemplazado en caso dado un átomo de carbono por oxígeno o por azufre y está substituido, en caso dado, por metilo o

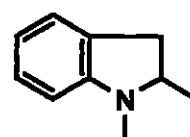
A y D significan junto con los átomos, con los que están enlazados, uno de los grupos AD siguientes:



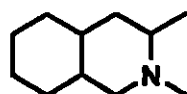
AD-1



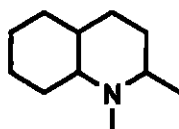
AD-2



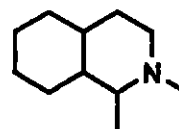
AD-3



AD-4



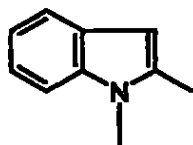
AD-6



AD-8

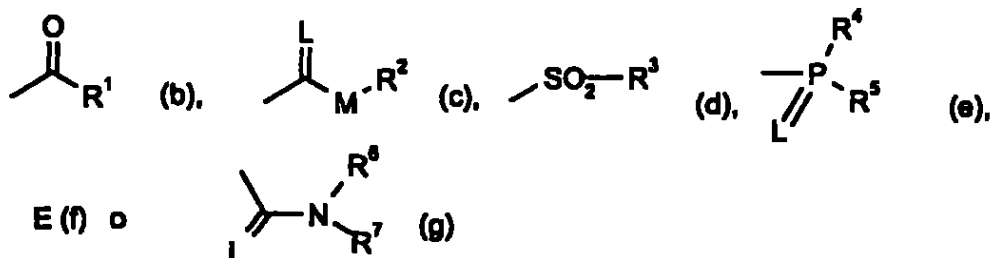
20

292
296



AD-10

G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos



en los cuales

- 5 E significa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,
 L significa oxígeno o azufre y
 M significa oxígeno o azufre,
 R¹ significa alquilo con 1 a 14 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 14 átomos
 10 de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átomos de
 carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor o significa
 ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso
 dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo o por metoxi,
 15 significa fenilo substituido en caso dado de una a dos veces por flúor, por
 cloro, por bromo, por ciano, por nitro, por metilo, por etilo, por terc.-butilo,
 por metoxi, por etoxi, por trifluormetilo o por trifluormetoxi,
 significa tienilo o piridilo monosubstituidos respectivamente en caso dado
 por flúor, por cloro, por bromo o por metilo,
 20 R² significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 8 átomos de
 carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 2 a 3 átomos de

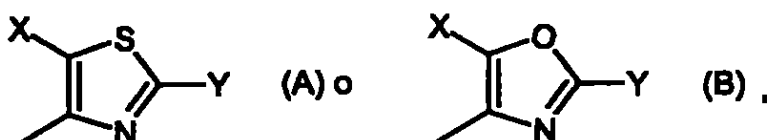
298
297

- carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor,
significa ciclohexilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por metilo,
por etilo, por n-propilo, por iso-propilo o por metoxi,
o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por
- 5 flúor, por cloro, por ciano, por nitro, por metilo, por etilo, por metoxi, por
trifluórmtilo o por trifluórmtoxi.
- R³ significa metilo, etilo, n-propilo o fenilo monosubstituido en caso dado por
flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por terc.-butilo, por metoxi, por
trifluórmtilo, por trifluórmtoxi, por ciano o por nitro,
- 10 R⁴ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de
carbono, alquilamino con 1 a 4 átomos de carbono, di-(alquilo con 1 a 4
átomos de carbono)amino, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o significa
fenilo, fenoxi o feniltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor,
por cloro, por bromo, por nitro, por ciano, por alcoxi con 1 a 2 átomos de
- 15 carbono, por flúoralcoxi con 1 a 2 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 2
átomos de carbono, por flúoralquiltio con 1 a 2 átomos de carbono o por
alquilo con 1 a 3 átomos de carbono,
- R⁵ significa metoxi, etoxi, metiltio o etiltio,
- R⁶ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos
- 20 de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 3 a 4 átomos
de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de
carbono, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por
bromo, por trifluórmtilo, por metilo o por metoxi, significa bencilo
substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por
- 25 trifluórmtilo o por metoxi,
- R⁷ significa hidrógeno, metilo, etilo, propilo o alilo, o
- R⁶ y R⁷ significan conjuntamente un resto alquilenos con 5 a 6 átomos de
carbono, en el cual está reemplazado en caso dado un grupo metileno por
oxígeno o por azufre.

299
258

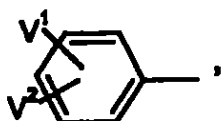
5.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Het significa

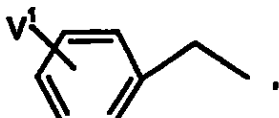


X significa hidrógeno, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo,

5 Y significa metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, terc.-butilo, trifluórmétilo o significa el grupo



o en el caso en que Het = tiazolilo ((I-1-A) hasta (I-3-A)) o significa también



10 V¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, trifluórmétilo, trifluórmétoxi, fenoxi, significa fenilo substituido en caso dado por cloro o por trifluórmétilo,

V² significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, etilo, metoxi o trifluórmétilo o

15 V¹ y V² significan conjuntamente -O-CH₂-O- o -O-CF₂-O-,

W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾, o azufre⁽³⁾,

A significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o ciclopropilo,

B significa hidrógeno o metilo o

A, B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan cicloalquilo con 5

20 a 6 átomos de carbono, saturado, en el cual están reemplazados en caso dado un miembro del anillo por oxígeno o por azufre y que está substituido en caso

300
299

dado una o dos veces por metilo, por etilo, por propilo, por isopropilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por propoxi, por butoxi o por iso-butoxi o significa cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, formando 2 átomos de carbono no directamente contiguos otro anillo de cinco miembros,

5 D significa hidrógeno,

D significa también i-propilo,

A y D significan junto con los átomos, con los que están enlazados, ciclohexilo, en el que puede estar reemplazado un átomo del anillo por azufre,

G significa hidrógeno (a) o en el caso en que Het = tiazolilo (I-1-A) hasta (I-3-

10 A), significa también los grupos



en los cuales

L significa oxígeno y

M significa oxígeno,

15 R¹ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro o significan ciclopropilo o ciclohexilo substituidos en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo o por metoxi,

20 significa fenilo monosubstituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por ciano, por nitro, por metilo, por etilo, por n-propilo, por i-propilo, por terc.-butilo, por metoxi, por etoxi, por i-propoxi, por terc.-butoxi, por trifluórmétilo o por trifluórmétoxi,

25 significa tienilo o piridilo monosubstituidos respectivamente en caso dado por cloro o por metilo,

R² significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de

20
300

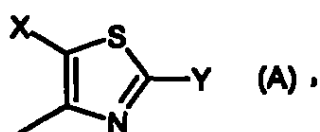
carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 2 a 3 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por flúor,

significa ciclohexilo substituido en caso dado por metilo, por etilo, por n-propilo, por iso-propilo o por metoxi,

- 5 o significa fenilo o bencilo monosubstituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por ciano, por nitro, por metilo, por etilo, por metoxi, por trifluórmétilo o por trifluórmétoxi.

6.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

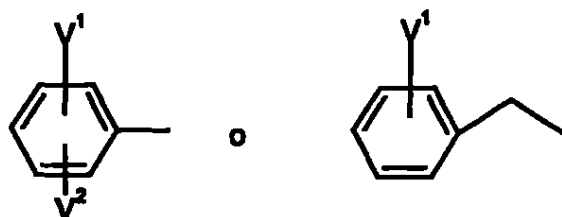
Het significa



10

X significa metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, cloro o bromo,

Y significa metilo, etilo, n-propilo o i-propilo o significa los grupos



en los cuales

- 15 V¹ significa hidrógeno, bromo, cloro, metilo, trifluórmétilo, fenoxi o t-butoxi o significa fenilo substituido en caso dado por cloro o por trifluórmétilo,

V² significa hidrógeno, cloro, flúor o metoxi o

V¹ y V² significan conjuntamente -O-CH₂-O- o -O-CF₂-O-,

W significa N-D⁽¹⁾, oxígeno⁽²⁾ o azufre⁽³⁾,

- 20 D significa hidrógeno o i-propilo

A significa metilo, etilo, n- o i-propilo o ciclopropilo o hidrógeno

B significa hidrógeno o metilo o

A y B y el átomo, con el que están enlazados, significan ciclohexilo, en el que está

302
301

reemplazado en caso dado un átomo del anillo por oxígeno y que está substituido en caso dado una o dos veces por metilo, por etilo, por metoxi o por etoxi o significa ciclohexilo, formando 2 átomos de carbono, no directamente contiguos, otro anillo con 5 miembros,

- 5 A y D significan junto con los átomos, con los que están enlazados, ciclohexilo, en el que puede estar reemplazado un átomo del anillo por azufre,
G significa hidrógeno (a) o significa uno de los grupos



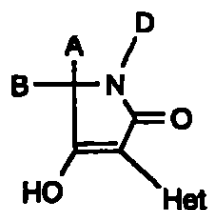
donde

- 10 R^1 significa metilo, etilo, n-propilo o i-propilo o significa fenilo o piridilo substituidos respectivamente en caso dado por cloro,
 R^2 significa metilo, etilo, fenilo, bencilo, n- o i-propilo.
7.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que
X significa metilo o etilo,
15 Y significa fenilo substituido en caso dado por cloro,
A significa metilo, etilo, n- o i-propilo,
B significa metilo, o
A y B y el átomo de carbono, con el que están enlazados, significan ciclohexilo, que está substituido en caso dado por metoxi o por metilo,
20 W significa N-D u oxígeno,
D significa hidrógeno,
G significa hidrógeno.

8.- Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizado porque

- 25 (A) se obtienen los compuestos de las fórmulas (I-1-A-a) hasta (I-1-B-a)

~~108~~
302



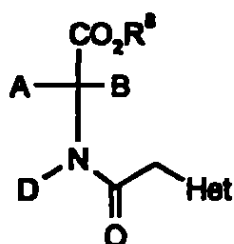
(I-1-A-a) hasta (I-1-B-a)

en la que

A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados,

si

- 5 se condensan intramolecularmente los compuestos de la fórmula (II)



(II)

en la que

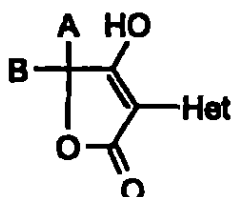
A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados,

y

- 10 R^8 significa alquilo,

en presencia de un diluyente y en presencia de una base,

- (B) se obtienen los compuestos de la fórmula (I-2-A-a) hasta (I-2-B-a)



(I-2-A-a) hasta (I-2-B-a)

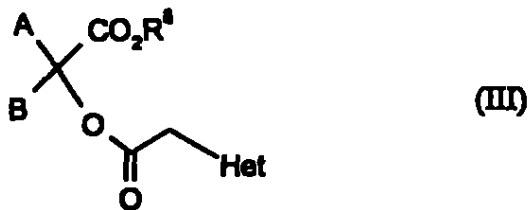
en la que

- 15 A, B y Het tienen los significados anteriormente indicados,

si

se condensan intramolecularmente compuestos de la fórmula (III)

303

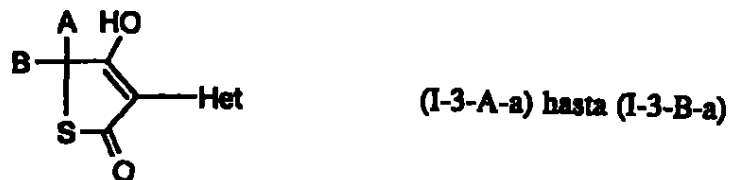


en la que

A, B, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados,

en presencia de un diluyente y en presencia de una base,

- 5 (C) se obtienen los compuestos de la fórmula (I-3-A-a) hasta (I-3-B-a)

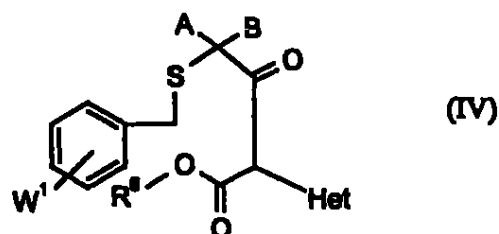


en la que

A, B y Het tienen los significados anteriormente indicados,

si

- 10 se ciclan intramolecularmente compuestos de la fórmula (IV)



en la que

A, B, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados y

W^1 significa hidrógeno, halógeno, alquilo o alcoxi,

- 15 en caso dado en presencia de un diluyente y en presencia de un ácido,
y en caso dado los compuestos, obtenidos de este modo de las fórmulas (I-1-A-a)
hasta (I-3-B-a), en las que

305
309

A, B, D y Het tienen respectivamente los significados anteriormente indicados, se hacen reaccionar respectivamente,

(D) (α) con halogenuros de acilo de la fórmula (V)



5 en la que

R^1 tiene el significado anteriormente indicado y

Hal significa halógeno,

o

(β) con anhídridos de ácidos carboxílicos de la fórmula (VI)

10 $\text{R}^1-\text{CO}-\text{O}-\text{CO}-\text{R}^1 \quad (\text{VI})$

en la que

R^1 tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido;

15 (E) con ésteres del ácido clorofórmico o con tioésteres del ácido clorofórmico de la fórmula (VII)



en la que

R^2 y M tienen los significados anteriormente indicados,

20 en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido;

(F) con ésteres del ácido cloromonotiofórmico o con ésteres del ácido cloroditiofórmico de la fórmula (VIII)

~~306~~
305



en la que

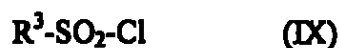
M y R² tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente

5 aceptor de ácido,

y

(G) con cloruros de sulfonilo de la fórmula (IX)



en la que

10 R³ tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente

aceptor de ácido,

(H) con compuestos del fósforo de la fórmula (X)



15 en la que

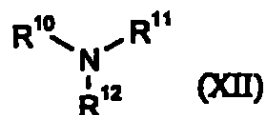
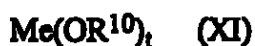
L, R⁴ y R⁵ tienen los significados anteriormente indicados y

Hal significa halógeno,

en caso dado, en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente

aceptor de ácido,

20 (I) con compuestos metálicos o con aminas de las fórmulas (XI) o (XII)



207
366

en las que

Me significa un metal monovalente o divalente,

t significa el número 1 o 2, y

R^{10}, R^{11}, R^{12} independientemente entre sí, significan hidrógeno o alquilo,

5 en caso dado en presencia de un diluyente,

(J) (α) con isocianatos o con isotiocianatos de la fórmula (XIII)



en la que

R^6 y L tienen los significados anteriormente indicados,

10 en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un catalizador o

(β) con cloruros de carbamidilo o con cloruros de tiocarbamidilo de la fórmula (XIV)

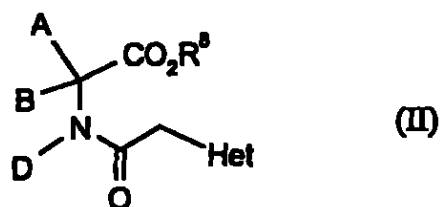


15 en la que

L, R^6 y R^7 tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido.

9.- Compuestos de la fórmula (II)



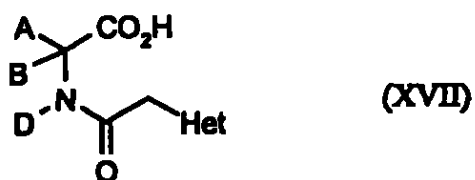
20

en la que

A, B, D, Het y R^8 tienen los significados anteriormente indicados.

208
307

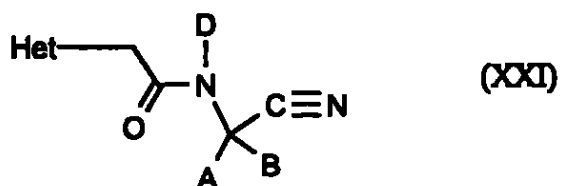
10.- Compuestos de la fórmula (XVII)



en la que

A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados.

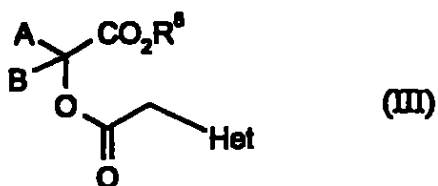
5 11.- Compuestos de la fórmula (XXI)



en la que

A, B, D y Het tienen los significados anteriormente indicados.

12.- Compuestos de la fórmula (III)

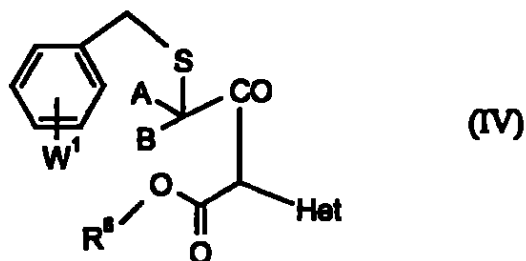


10

en la que

A, B, Het y R⁸ tienen los significados anteriormente indicados.

13.- Compuestos de la fórmula (IV)



303

en la que

A, B, W¹, Het y R⁸ tienen los significados anteriormente indicados, y

W¹ significa hidrógeno, halógeno, alquilo o alcoxi.

14.- Agentes pesticidas y agentes para la lucha contra las malas hierbas,
5 caracterizados porque tienen un contenido en al menos un compuesto de la fórmula
(I) según la reivindicación 1.

15.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1
para la lucha contra las pestes y contra las malas hierbas.

16.- Procedimiento para la lucha contra las pestes y contra las malas hierbas,
10 caracterizado porque se dejan actuar compuestos de la fórmula (I) según la
reivindicación 1, sobre las pestes y/o sobre su medio ambiente o se dejan actuar
sobre las malas hierbas y/o sobre su medio ambiente.

17.- Procedimiento para la obtención de agentes pesticidas y de agentes para
la lucha contra las malas hierbas, caracterizado porque se mezclan compuestos de la
15 fórmula (I) según la reivindicación 1, con extendedores y/o con agentes
tensioactivos.

18.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1,
para la obtención de agentes pesticidas y de agentes para la lucha contra las malas
hierbas.



FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Bogotá, Colombia

309

Expediente No		02112979	No de Follo
Item		No de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	1	✓
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones:

contiene Arte final

310

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176089

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 02112979 00000000

Folios: 311

Fecha (AÑO): 2002-12-13 00:55:36

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NUCI 411 PRESENTAC

Remediar: PARA DISTRIBUCION DE MEDIDAS DE PROTECCION

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 02 - 78,528
FECHA : NOVIEMBRE 25 DE 2002

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	3136962	25/11/2002	23,104,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. CONTABILITICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	378,000.00
	TOTAL :	\$ 378,000.00

SOL: TRESCIENTOS SETENTA Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____ 207

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

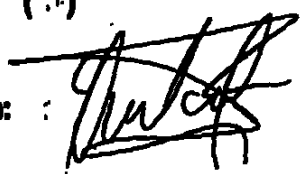
Calo 00698-841-009-5

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador 382 0840
Fax 350 5220
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

312
311

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL
TRAMITE

		USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION ☒ MODELO DE UTILIDAD ☒		()	()
1 -	Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	()
1 -	Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()
123 -	Descripción de la invención.	()	()
	Dibujos de ser estos pertinentes.	()	()
311 -	Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA () INCOMPLETA ()			
DISEÑO INDUSTRIAL ()			
-	Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
-	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.	()	()
-	Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.	()	()
-	Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA () INCOMPLETA ()			
ESQUEMA DE TRAZADO ()			
-	Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado.	()	()
-	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta La solicitud.	()	()
	Representación gráfica del esquema de trazado	()	()
	Comprobante de pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA () INCOMPLETA ()			

Firma Responsable: 

Fecha: **SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO** Folios: 311
Radicación: 02112979 00000000
Fecha (HH): 0802-12-13 06:55:36
Trámite: 011 PCT-PATENT 379 FINE INCI 411 PRESENTAC
Remisión: PARA OTORGAR DE MARCA REGISTRADA