



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

04-118274

54. TITULO

DERIVADOS DE PIRIDIN-3-CARBONILO 2,6-SUSTTUIDO QUE SIRVEN
COMO AGENTES DE PROTECCION DE PLANTAS QUE TIENEN ACCION
HERBICIDA

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AG.

DOMICILIO

Monheim, República Federal de Alemania.

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén.

22. BOGOTA, D.C.,



PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 04118274 00000000

Folios: 153

Fecha (MM): 2004-11-24 16:56:25

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

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 CROPSCIENCE AG sociedad constituida y existente bajo las leyes de la República Federal de Alemania Dirección: Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim, República Federal de Alemania Domicilio: Monheim, 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 38 11 Fax:: 217 92 11 E-mail: clientes@camyp.com. Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número: 438.019 T.P. 31.929
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Hans-Georg SCHWARZ Heinenbusch 19a, 40764 Langenfeld, República Federal de Alemania 2. Dorothee HOISCHEN Hortensienstr. 31, 40764 Düsseldorf República Federal de Alemania 3. Kristian KATHER Stefenshovener Str. 54a, 40764 Langenfeld, República Federal de Alemania 4. Klaus-Helmut MÜLLER Solfstr. 19, 40593 Düsseldorf, República Federal de Alemania 5. Mark Wilhelm DREWES Goethestr. 38, 40764 Langenfeld, República Federal de Alemania 6. Peter DAHMEN Altebrücker Str. 61, 41470 Neuss, República Federal de Alemania 7. Dieter FEUCHT Ackerweg 9, 40789 Monheim, República Federal de Alemania 8. Rolf PONTZEN Am Kloster 69, 42799 Leichlingen, República Federal de Alemania	

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP03/03948Fecha: 16 de abril de 2003Publicación Internacional No. WO 03/092380 A1Fecha: 28 de noviembre de 2003

6

Título (54)

**DERIVADOS DE PIRIDIN-3-CARBONILO 2,6-SUSTITUIDO
QUE SIRVEN COMO AGENTES DE PROTECCIÓN DE PLANTAS
QUE TIENEN ACCIÓN HERBÍDICA**

7

Clasificación Internacional (51) A01N 43/50, 43/53, 43/54, 43/713, 43/36, 43/56, 43/78,
43/80, 43/76, C07D 401/06, 401/14, 401/12

8

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒ NO ☐DE29 de abril de 2002102 19 036.4

9

Comprobante de pago No.: 04 - 87.144Fecha: 08 de noviembre de 2004

10

Anexos:



Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 422.000.00.



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. De acuerdo con la Regla 4.17 (ii) del PCT con relación a la autorización de la compañía solicitante a solicitar y obtener una patente por la relación laboral con los inventores y un acuerdo entre el solicitante original y el solicitante de la solicitud internacional del 24 de Octubre de 2002 y de acuerdo con la regla 4.17 (iii) del PCT con relación a la autorización del solicitante de reivindicar la prioridad de solicitud de patente anterior (No.10219036.4) por un acuerdo entre el solicitante original y el solicitante de la solicitud internacional del 01 de abril de 2003.



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



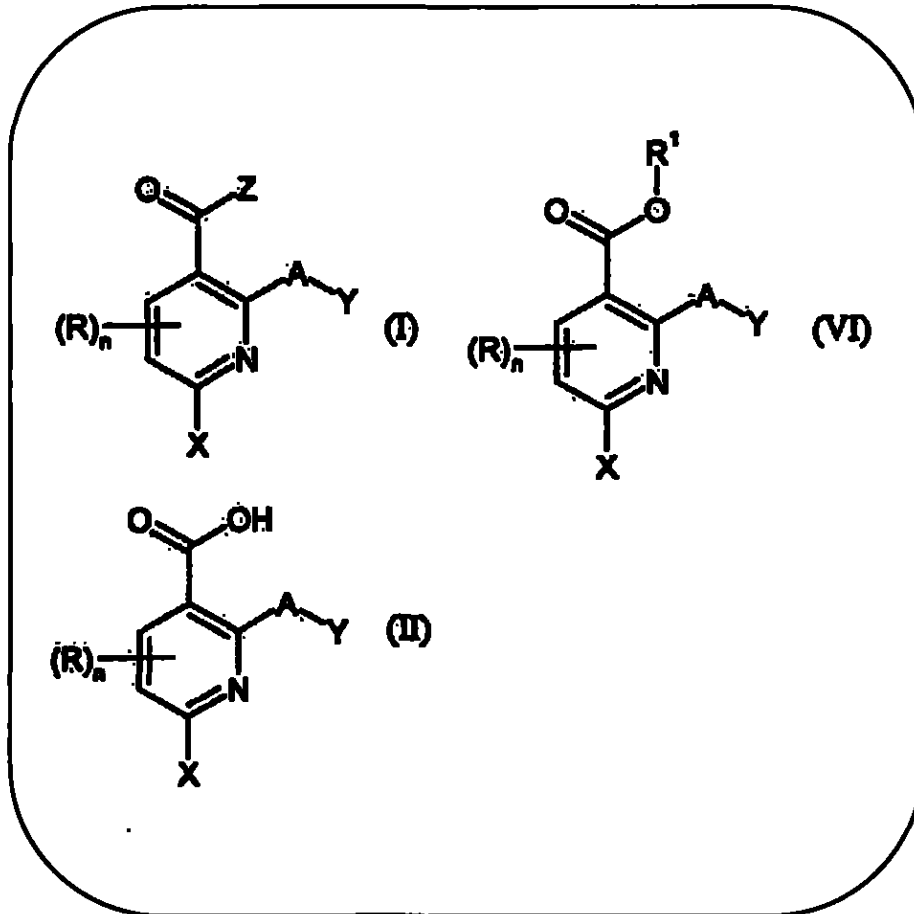
De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.



Otros: Traducción a español de las declaraciones contenidas en la Solicitud PCT con relación a la autorización de la compañía a solicitar y obtener una patente y a reivindicar una prioridad.

11

FIGURA CARACTERISTICA:



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA:

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

DLM

Representación y Poder con autenticación notarial y Apostille para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, lemas comerciales, licencias.

Representation and Power-of-Attorney with notarial authentication and Apostille for patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, domain names, slogans, licenses.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER-OF-¹³⁵⁴⁹
ATTORNEY ¹⁰⁹⁶⁶

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

domiciliado (s) en/of Alfred-Nobel-Str. 50,

40789 Monheim, Germany, hereby ratify the patent application

No. 03.005.574 filed by Emilio FERRERO on January 28, 2003 and

por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, 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

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa. 832, 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 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,

5
...rativo, contencioso administrativo y judicial, así como los
iales (lo arbitramento; en todo lo concerniente a los siguientes
atos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y
seños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas,
defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales,
enseñas, nombres de dominio, 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, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de
agentes oficiosos.

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, domain
names, 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.

Dado y firmado hoy/Given and signed this 12th of February, 2003
en/in Leverkusen
por/by Dr. Axel Bader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

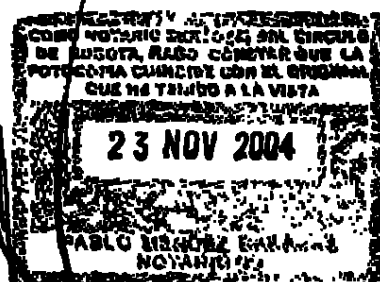
Firma

Signature

Bayer CropScience AG

Ma. BL

P. Bader



NOTIFICACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

ascribo Notario Certifica: Que la firma que antecede de Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

auténtica; que el signatario desempeña actualmente el cargo de Secretaria de la compañía Bayer CropScience AG

sociedad que actualmente existe y está organizada de acuerdo a las leyes de Alemania

que la dirección de dicha compañía es Alfred Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania

y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.

Todos los hechos anteriores le constan por haber examinado los documentos respectivos y de todo ello da fe.

Dado y firmado en Leverkuse

El 12 de febrero, 2003

El Notario Público
(Firma-sello)

The Notary Public
(Signature-seal)



NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies: That the preceding signature of

Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

is authentic, that the signatory currently acts in the position of

secretaries

of the company Bayer CropScience AG

a company currently existing and organized under the laws of Germany

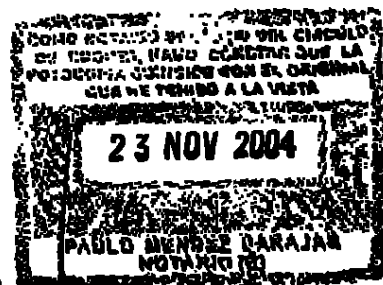
that the address is Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Germany

and that the signatory has the power to grant this document.

The Notary Public is aware and attests to the above facts upon examination of the corresponding documents.

Given and signed in Leverkuse

On 12th of February, 2003



7

URNr. 242/2003

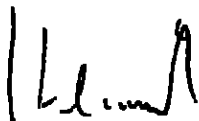
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

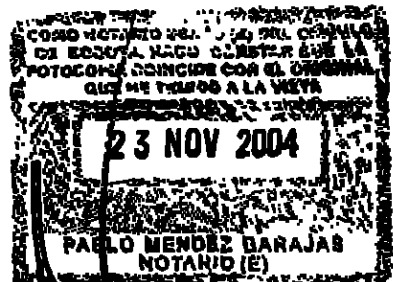
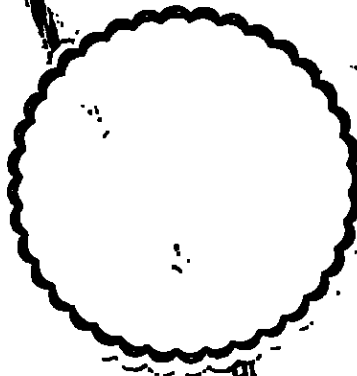
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht in das Handelsregister des
Amtsgerichts Langenfeld - HRB 3990 -, daß die genannten Herren
berechtigt sind, die Bayer CropScience Aktiengesellschaft in
Monheim am Rhein als Prokuristen einzeln zu vertreten.

Leverkusen, den 12. Februar 2003


Notar



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2. Ist unterschrieben von _____

Dirk Heiderhoff

3. In seiner Eigenschaft als Notar _____

4. sie ist versehen mit dem Stempel/Siegel des (der) _____

Notars Dirk Heiderhoff

in Leverkusen

Bestätigt 17. FEB. 2003

5. in Köln

6. am _____

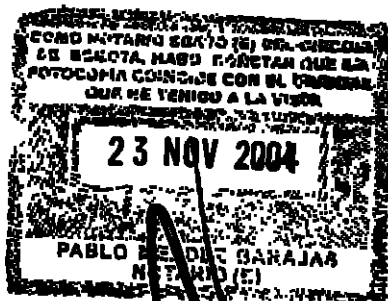
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln

8. unter Nr. 482103

9. Stempel/Siegel:

10. Unterschrift:

Lairin Callebe



Kostenrechnung

	10.-
	10.-
Geb. 100	EUR 13.-
	528
	528

Notar

82

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 10.09/02 realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No. 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia y registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia.

A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Bayer CropScience AG, domiciliado en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania, por el presente ratifica la solicitud de patente No. 03.005.574, presentada por EMILIO FERRERO el 28 de enero de 2003 y otorga derechos de representación y poder a los Doctores EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ, tpa. 23555 y GERMÁN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4° No. 72-35.

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003

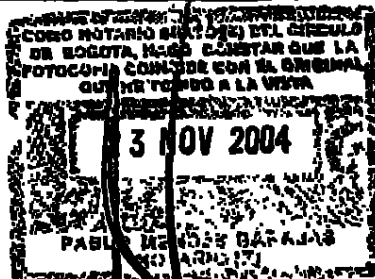
en Leverkusen

por Dr. Axel Brader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Bayer CropScience AG

Firma Ilegible

Firma Ilegible



(ANEXO)

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (SOCIEDAD) en donde se certifican la firma anterior del Doctor Axel Bader y del Doctor Ralf-Rüdiger Jesse como

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS Z.

TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999

9

Secretarios de Bayer CropScience AG, una sociedad actualmente existente y organizada de acuerdo a las leyes de Alemania y con dirección en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania. Dado y firmado en Leverkusen el 12 de febrero del 2003.

Firma Ilegible
Notario Público

Sello

Se anexa autenticación notarial en alemán de las firmas anteriores.

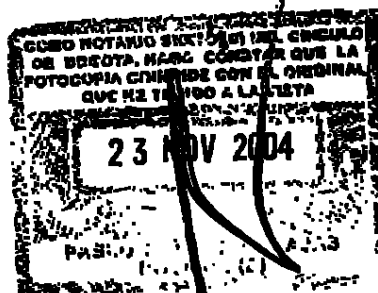
Respaldo:

Apostilla expedida por Alemania y certificado el de febrero de 2003 bajo el número 482/03.

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en esta oficina para su confrontación.

DVZ/ID-4268/WPCL002G/COLO 13549-841-002-0

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA



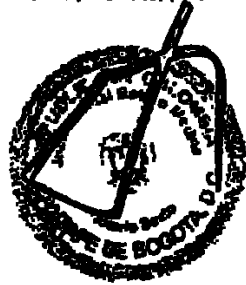
BO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
2003 MAR 18 P 12:24
JEFE DE DESPACHOS
BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIORES FIR-
MA(S) PUESTA(S) POR Vergara
IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)
ES(SON) AUTENTICA(S)
SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208992
D.F. Vergara
BOYA FIRMA A PARCE EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
COPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
23 NOV 2004
PABLO MELO BARACAS
NOTARIO



TRADUCCION OFICIAL No. 9450

de un documento escrito en Alemán, efectuada por Luz Arriaga de Herber, resolución del Ministerio de Justicia 599 del 6 de marzo 1978.-

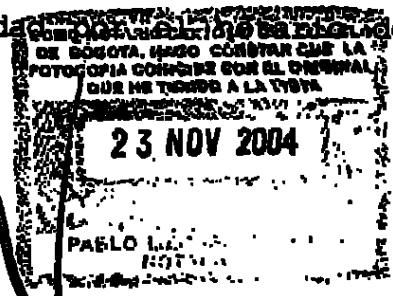
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia. Dado y firmado el 12 de febrero 2003 en Leverkusen, Alemania, por los señores Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse.

Autenticación en español e inglés de las firmas antecedentes y certificación de existencia de la sociedad de la ciudad de Leverkusen, Dirk Heiderhoff.

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen



LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCCION OFICIAL
Resolución 599 del 6 de marzo 1978

Protocolo notarial 242/2003

Certifico la autenticidad de la firma antecedentes puestas
ante mí por los señores

1. Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, con domicilio comercial en D-51368, Bayerwerk, Alemania,
2. Dr. Axel Bader, con domicilio comercial en D-51368, Bayerwerk, Alemania,

a quienes conozco en persona.

Certifico, por haber tenido la lista el registro de comercio del Juzgado Municipal de Langenfeld -HRB 3990- que los mencionados señores están facultados, en su calidad de apoderados, para representar individualmente a la firma Bayer CropScience Aktiengesellschaft, domiciliada en Monheim am Rhein.

Leverkusen, 12 de febrero 2003
(Hilo y oblea notarial)
Edo.: firma ilegible, Notario

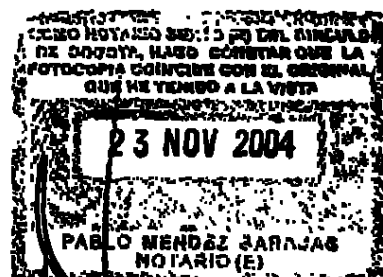
Costas

Art. 141, 154 KostO

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45

EUROS 10,-



1112 APRIL 11 DE 1988
INGENIERO (TOP) DE 1988 E OFICIAL
Resolución No. 12.000/88

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993

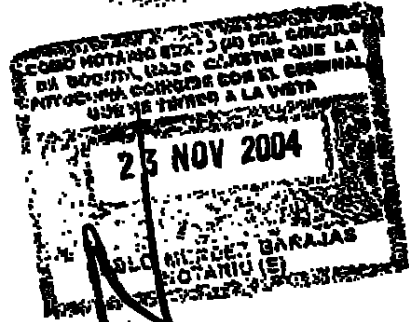
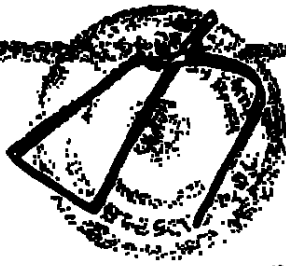
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAR 18 P 12:24

JEFES DE SECCIONES
SECRETARIA D.E.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOCA, HA CONSTATADO QUE LOS ANTES OR(ES) FIR-
MANTE(S) PUESTO(S) POR Guillermo J. de
Tejera
IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s) _____
ES(SON) AUTENTICA(S)
SANTAFE DE BOCA, 18 MAR 2003



(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
13. November 2003 (13.11.2003)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

PCT

WO 03/092380 A1 not JS

(51) Internationale Patentklassifikation: A01N 43/50,
43/53, 43/54, 43/713, 43/36, 43/56, 43/78, 43/80, 43/76,
C07D 401/06, 401/14, 401/12

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/03948

(22) Internationales Anmeldedatum:
16. April 2003 (16.04.2003)

(25) Erreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 19 036.4 29. April 2002 (29.04.2002) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHWARZ,
Hans-Georg [DE/DE]; Heinenbosch 19e, 40764 Langen-
feld (DE). HOISCHEN, Dorothee [DE/DE]; Horten-
sienstr. 31, 40764 Düsseldorf (DE). KATHER, Kristian

[DE/DE]; Stappenhovener Str. 54a, 40764 Langenfeld
(DE). MÜLLER, Klaus-Helmut [AT/DE]; Solstr. 19,
40593 Düsseldorf (DE). DREWES, Mark, Wilhelm
[DE/DE]; Goethestr. 38, 40764 Langenfeld (DE). DAH-
MEN, Peter [DE/DE]; Althofstr. 61, 41470 Neuss
(DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9, 40789
Monheim (DE). PONTZEN, Rolf [DE/DE]; Am Kloster
69, 42799 Leichlingen (DE).

(74) Gemeinnütziger Vertreter: BAYER CROPSCIENCE
AKTIENGESELLSCHAFT; Law and Patents, Patents
and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AB, 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, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO,
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

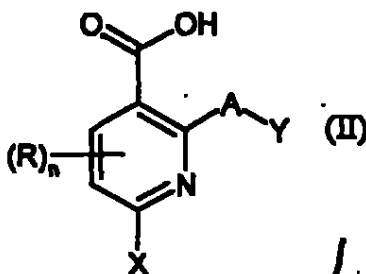
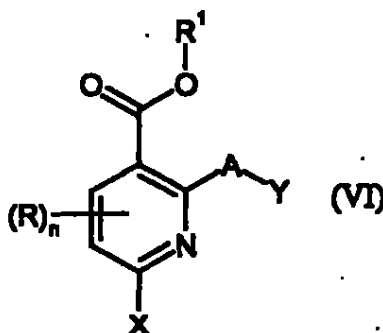
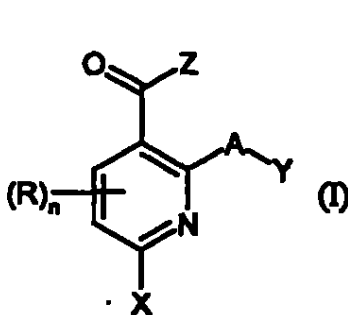
(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

LEA 36013

(54) Title: 2,6 SUBSTITUTED PYRIDINE-3-CARBONYL DERIVATIVES SERVING AS PLANT PROTECTION AGENTS
HAVING HERBICIDAL ACTION

(54) Bezeichnung: 2,6 SUBSTITUIERTE PYRIDIN-3-CARBONYL DERIVATE ALS PFLANZENSCHUTZMITTEL MIT HER-
BIZIDER WIRKUNG



(57) Abstract: The invention relates
to novel substituted pyridyl ketones of
formula (I), in which A, R, X, Y, Z
and n have the meanings as cited in the
description, to methods for producing
these novel substances, and to their use
as plant protection agents, particularly as
herbicides. The invention also relates to
novel intermediate products of formulas
(II) and (VI) and to methods for the
production thereof.

(57) Zusammenfassung: Neue
substituierte Pyridylketone der Formel (I),
in welcher A, R, X, Y, Z und n die in der
Beschreibung angegebenen Bedeutungen
haben, Verfahren zur Herstellung dieser
neuen Stoffe und deren Verwendung als
Pflanzenbehandlungsmittel, insbesondere
als Herbizide. Neue Zwischenprodukte der
Formeln (II) und (VI) sowie Verfahren zu
deren Herstellung.

LEA 36013

WO 03/092380 A1

TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungstaaten: 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, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY,

KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungstaaten

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

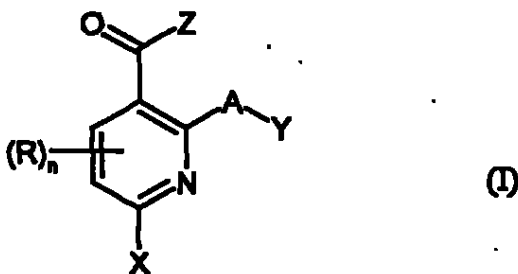
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

2,6 SUBSTITUIERTE PYRIDIN-3-CARBONYL DERIVATE ALS
PFLANZENSCHUTZMITTEL MIT HERBIZIDER WIRKUNG

Die Erfindung betrifft neue substituierte Pyridylketone, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel, insbesondere als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, dass bestimmte substituierte Pyridylketone herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. WO-A-01/66522, WO-A-00/39094, WO-A-00/15615, WO-A-96/17829, WO-A-96/14285 / EP-A-791572, WO-A-93/01171 / EP-A-641780, JP-A-04029973 – zitiert in Chem. Abstracts 116:230216, JP-A-03052862 – zitiert in Chem. Abstracts 115:226166, WO-A-91/00260 / EP-A-432275, JP-A-03038586 – zitiert in Chem. Abstracts 115:29323). Die Wirkung dieser Verbindungen ist jedoch nicht in allen Belangen zufriedenstellend.

Es wurden nun die neuen substituierten Pyridylketone der Formel (I)



in welcher

20

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht;

A für gegebenenfalls durch O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO oder SO₂ unterbrochenes Alkandiyl oder für α- oder ω-Oxaalkandiyl, α, ω-Dioxaalkandiyl, oder α- oder ω-Thiaalkandiyl oder α, ω-Dithiaalkandiyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht;

25

- R** für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht;
- 5
- X** für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht;
- 10
- Y** für einen gegebenenfalls durch Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen,
- 15 durch jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,
- 20 durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,
- durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen,
- 25
- durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder
- 30

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyl-oxy, Benzylthio oder Benzylamino,

5

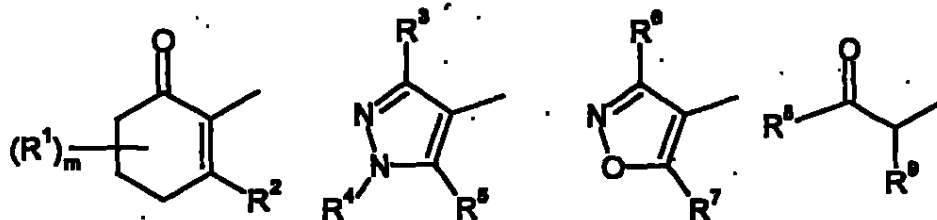
substituierten 4- bis 12-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten, mono-cyclischen oder bicyclischen, Heterocyclus, welcher 1 bis 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls zusätzlich ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO-Gruppierung oder eine SO₂-Gruppierung, 1 bis 3 Oxo-Gruppen (C=O), 1 bis 3 Thioxo-Gruppen (C=S) oder 1 bis 3 Cyanimino-Gruppen (C=N-CN) als Bestandteile des Heterocyclus enthält, über ein Stickstoffatom mit A verknüpft ist

10

steht und

15

Z für eine der nachstehenden Gruppierungen steht



20

wobei

m für die Zahlen 0 bis 6 steht,

25

R¹ für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für Phenyl steht, oder -für den Fall,

dass m für 2 bis 6 steht - gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R^1 für Sauerstoff- oder Alkandiyl (Alkylen) mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

- 5 R^2 für Hydroxy, Formyloxy, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy oder Alkylsulfonylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl substituiertes Aryloxy, Arylthio, Arylsulfinyl, Arylsulfonyl, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylsulfonylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylsulfinyl oder Arylalkylsulfonyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für eine Gruppierung Y' - wobei Y' die oben für Y angegebene Bedeutung hat, jedoch nicht in jedem Einzelfall mit Y identisch ist - steht,
- 10
- 15
- 20
- 25 R^3 für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 30

16

- 5
10
15
- R^4 für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl substituiertes Aryl oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- 20
25
30
- R^5 für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl substituiertes Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

- 5 **R⁶** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für
 jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy sub-
 stituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxy carbonyl, Alkylthio,
 Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoff-
 atomen steht,
- 10 **R⁷** für Wasserstoff; für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-
 Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für
 gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes
 Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 15 **R⁸** für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-
 Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für
 gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes
 Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und
- 20 **R⁹** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gege-
 benenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes
 Alkyl, Alkoxy, Alkoxy carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkyl-
 sulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen
 steht,
- 25 - einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der
 allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze bzw. Säure- oder Basen-
 Addukte der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) -

gefunden.

- 30 In den vorstehenden und nachfolgenden Definitionen gelten, sofern nicht anders aus-
 geführt, die nachfolgenden Definitionen:

17

5 Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl, Alkandiyl, Alkenyl oder Alkynyl, auch in Verknüpfung mit Heteroatomen, wie beispielsweise in Alkoxy, Alkylthio oder Alkylamino sind jeweils geradkettig oder verzweigt. Bevorzugt sind, falls nicht anders angegeben, Kohlenwasserstoffketten mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen.

10 Cycloalkyl steht für gesättigte, carbocyclische Verbindungen, die gegebenenfalls mit weiteren carbocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen ein polycyclisches Ringsystem bilden. Bevorzugt sind, falls nicht anders angegeben, Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl.

15 Aryl steht für aromatische, mono- oder polycyclische Kohlenwasserstoffringe, wie z.B. Phenyl, Naphthyl, Anthranyl, Phenanthryl, vorzugsweise Phenyl oder Naphthyl, insbesondere Phenyl.

20 Heterocyclyl steht für gesättigte, ungesättigte oder aromatische, ringförmige Verbindungen, in denen mindestens ein Ringglied ein Heteroatom, d.h. ein von Kohlenstoff verschiedenes Atom, ist. Enthält der Ring mehrere Heteroatome, können diese gleich oder verschieden sein. Heteroatome sind bevorzugt Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel. Enthält dieser Ring mehrere Sauerstoffatome, stehen diese nicht benachbart. Gegebenenfalls bilden die ringförmigen Verbindungen mit weiteren carbocyclischen oder heterocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen gemeinsam ein polycyclisches Ringsystem. Ein polycyclisches Ringsystem kann über
25 den heterocyclischen Ring oder einen ankondensierten carbocyclischen Ring verknüpft sein. Bevorzugt sind mono- oder bicyclische Ringsysteme, insbesondere monocyclische Ringsysteme mit 5 oder 6 Ringgliedern und bicyclischen Ringsysteme mit 7 bis 9 Ringgliedern.

30 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) enthalten gegebenenfalls ein oder mehrere asymmetrisch substituierte Kohlenstoffatome und

können deshalb in verschiedenen enantiomeren (R- und S- konfigurierten) bzw. diastereomeren Formen vorliegen. Die Erfindung betrifft sowohl die verschiedenen möglichen einzelnen enantiomeren bzw. stereoisomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wie auch die Gemische dieser stereoisomeren Verbindungen.

Bevorzugte Substituenten bzw. bevorzugte Bereiche der oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste werden im Folgenden definiert.

10 n steht bevorzugt für die Zahlen 0 oder 1.

15 A steht bevorzugt für gegebenenfalls durch O, SO oder SO₂ unterbrochenes Alkandiy l oder für α - oder ω -Oxaalkandiy l, α,ω -Dioxaalkandiy l, α - oder ω -Thiaalkandiy l oder α,ω -Dithiaalkandiy l mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

20 R steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

25 X steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

30 Y steht bevorzugt für einen gegebenenfalls durch Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen,

durch jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl-, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

5

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

10

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 5 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen,

15

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder

20

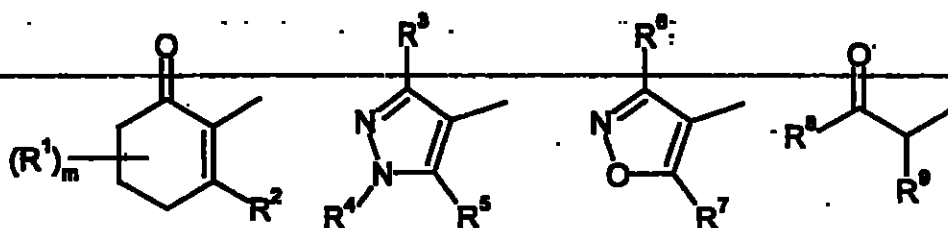
durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenylloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzylloxy, Benzylthio oder Benzylamino

25

substituierten 4- bis 12-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten, monocyclischen oder bicyclischen, Heterocyclus, welcher 1 bis 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls zusätzlich ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO-Gruppierung, eine SO₂-Gruppierung, 1 oder 2 Oxo-Gruppen (C=O), Thioxo-Gruppen (C=S) oder Cyanimino-Gruppen (C=N-CN) als Bestandteile des Heterocyclus enthält und welcher über ein Stickstoffatom mit A verknüpft ist.

30

Z steht bevorzugt für eine der nachstehenden Gruppierungen



wobei

5

m für die Zahlen 0 bis 5 steht,

10

R^1 für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, oder für Phenyl steht, oder - für den Fall, dass m für 2 bis 5 steht - gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R^1 für Sauerstoff oder Alkandiyl (Alkylen) mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

15

R^2 für Hydroxy, Formyloxy, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy oder Alkylsulfonyl-amino mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl substituiertes Aryloxy,

20

25

Arylthio, Arylsulfinyl, Arylsulfonyl, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylsulfonylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylsulfinyl oder Arylalkylsulfonyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für eine Gruppierung Y' - wobei Y' die oben für Y als bevorzugt angegebene Bedeutung hat, jedoch nicht in jedem Einzelfall mit Y identisch ist - steht,

R³ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R⁴ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 3 bis 5 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl substituiertes Aryl oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoff-

atomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

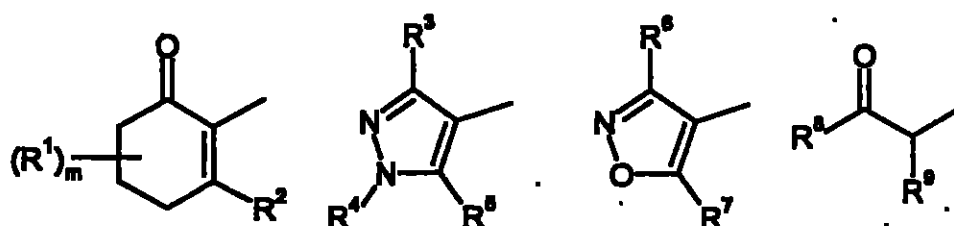
- 5 R^5 für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 3 bis 5 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl substituiertes Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- 10
- 15
- 20 R^6 für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,
- 25 R^7 für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 30 R^8 für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, oder für

gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und

- 5 **R⁹** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht.
- 10 **n** steht besonders bevorzugt für die Zahl 0.
- 15 **A** steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls durch O, S, SO oder SO₂ unterbrochenes Alkandiyl oder für α- oder ω-Oxaalkandiyl oder α- oder ω-Thiaalkandiyl mit jeweils 1, 2 oder 3 Kohlenstoffatomen.
- 20 **R** steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.
- 25 **X** steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.
- 30 **Y** steht besonders bevorzugt für einen gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, durch jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Alkylsulfinyl oder C₁-C₃-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkyl-

sulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, durch
 jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkyl-
 amino mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, durch
 jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl,
 5 Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoff-
 atomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, durch jeweils gegebenenfalls
 durch Halogen und/oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyl-
 oxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy,
 10 Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlen-
 stoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlen-
 stoffatomen im Alkylteil, oder durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen,
 C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio,
 Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino sub-
 15 stituierten 4- bis 12-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten, mono-
 cyclischen oder bicyclischen, über N (ein Stickstoffatom) mit A verknüpften
 Heterocyclus, welcher 1 bis 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls zusätzlich
 ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO-Gruppierung, eine SO₂-
 Gruppierung, 1 oder 2 Oxo-Gruppen (C=O), 1 oder 2 Thioxo-Gruppen (C=S),
 20 oder eine Cyanimino-Gruppe (C=N-CN) als Bestandteile des Heterocyclus
 enthält.

Z steht besonders bevorzugt für eine der nachstehenden Gruppierungen



25

wobei

m für die Zahlen 0 bis 4 steht,

- 5 R^1 für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_3 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Alkylthio, C_1 - C_3 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_3 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder für Phenyl steht, oder - für den Fall, dass m für 2 bis 5 steht - gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R^1 für Sauerstoff oder Alkandiyl (Alkylen) mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen steht,
- 10 R^2 für Hydroxy, Formyloxy, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_3 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Alkylthio, C_1 - C_3 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_3 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy oder Alkylsulfonyl-amino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 3 bis 5 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_3 -Alkyl, C_1 - C_3 -Halogenalkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Halogenalkoxy, C_1 - C_3 -Alkylthio, C_1 - C_3 -Halogenalkylthio, C_1 - C_3 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_3 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_3 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_3 -Halogenalkylsulfonyl substituiertes Aryloxy, Arylthio, Arylsulfinyl, Arylsulfonyl, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylsulfonylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylsulfinyl oder Arylalkylsulfonyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 oder 2 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für eine Gruppierung Y^* - wobei Y^* die oben für Y als besonders bevorzugt angegebene Bedeutung hat, jedoch nicht in jedem Einzelfall mit Y identisch ist - steht,
- 20
- 25
- 30 R^3 für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_3 -

5 Alkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Alkylsulfinyl oder C₁-C₃-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

10 R⁴ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Alkylsulfinyl oder C₁-C₃-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Halogenalkylthio, C₁-C₃-Alkylsulfinyl, C₁-C₃-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₃-Alkylsulfonyl oder C₁-C₃-Halogenalkylsulfonyl substituiertes Aryl oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 oder 2 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

25 R⁵ für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls Cyano, Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkynyloxy mit jeweils 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-

- 5 Halogenalkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Halogenalkylthio, C₁-C₃-Alkylsulfinyl, C₁-C₃-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₃-Alkylsulfonyl oder C₁-C₃-Halogenalkylsulfonyl substituiertes Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 oder 2 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- 10 R⁶ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- 15 R⁷ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 20 R⁸ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und
- 25 R⁹ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht.
- 30 A steht ganz besonders bevorzugt für Methylen, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), 1-Oxa-ethan-1,2-diyl, 2-Oxa-ethan-1,2-diyl, 1-Thia-ethan-1,2-diyl, 2-Thia-

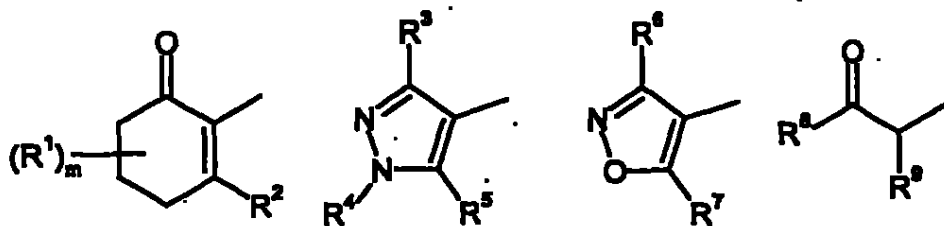
ethan-1,2-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl (Trimethylen), 1-Oxa-propan-1,3-diyl, 2-Oxa-propan-1,3-diyl, 3-Oxa-propan-1,3-diyl, 1-Thia-propan-1,3-diyl oder 3-Thia-propan-1,3-diyl.

- 5 R steht ganz besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino oder Dimethylaminosulfonyl.
- 10
- X steht ganz besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino oder Dimethylaminosulfonyl.
- 15
- Y steht ganz besonders bevorzugt für einen gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, durch jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, durch jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino, durch jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenylamino, durch jeweils ge-
- 20
- 25
- 30

gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopropylmethylthio, Cyclobutylmethylthio, Cyclopentylmethylthio, Cyclohexylmethylthio, Cyclopropylmethylamino, Cyclobutylmethylamino, Cyclopentylmethylamino oder Cyclohexylmethylamino, oder durch jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino substituierten über Stickstoff mit A verknüpften Heterocyclus aus der Reihe Pyrrolidinyl, Oxopyrrolidinyl, Pyrrolyl, Indolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Imidazoliny, Imidazolidinyl, Oxoimidazoliny, 2-Oxo-1,3-diaza-cyclopentyl, 2-Oxo-1,3-diaza-cyclopentenyl, Oxazolidinyl, 2-Oxo-1,3-oxaza-cyclopentyl (2-Oxo-oxazolidinyl), 1,2-Oxaza-cyclopentyl (Isoxazolidinyl), 1,2-Oxaza-cyclohexyl, Thiazolidinyl, Cyaniminothiazolidinyl, Oxotriazoliny, Thioxotriazoliny, Oxotetrazoliny, Piperidinyl, Oxopiperidinyl, 2-Oxo-1,3-diaza-cyclohexyl, 2-Oxo-1-aza-cycloheptyl, 2-Oxo-1,3-diaza-cycloheptyl, Morpholiny, Piperazinyl.

Z steht ganz besonders bevorzugt für eine der nachstehenden Gruppierungen

25



wobei

m für die Zahlen 0 bis 3 steht,

- 5 R^1 für Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, oder für Phenyl steht, oder - für den Fall, dass m für 2 oder 3 steht -
10 gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R^1 für Sauerstoff, Methylen oder Dimethylen (Ethan-1,2-diyl) steht,
- 15 R^2 für Hydroxy, Chlor, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methylsulfonylamino oder Ethylsulfonylamino, für
20 jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl
25 substituiertes Phenylloxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl, Phenylcarbonyloxy, Phenylcarbonylmethoxy, Phenylsulfonyloxy,
- 30

24

Phenylsulfonylamino, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio, Phenylmethylsulfinyl oder Phenylmethylsulfonyl steht,

- 5 R^3 für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,
- 10
- 15 R^4 für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Trifluormethylsulfonyl substituiertes Phenyl oder Phenylmethyl steht,
- 20
- 25
- 30

- 5
10
15
20
25
30
- R^5 für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Trifluormethylsulfonyl substituiertes Phenylmethoxy, Phenylcarbonyloxy, Phenylcarbonylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy steht,
- R^6 für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl steht,
- R^7 für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

5 R^8 für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht, und

10 R^9 für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl steht.

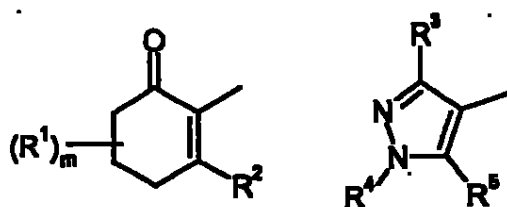
15 Besonders hervorgehoben seien Verbindungen der Formel (I)

in welcher

n, A, X und Y die vorstehend genannten Bedeutungen hat und

20

Z für eine der nachstehenden Gruppierungen steht



25

wobei

m für die Zahlen 0 bis 3 steht,

- R¹** für Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, Methylthio, Ethylthio, oder für Phenyl steht,
- 5
- R²** für Hydroxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methylsulfonylamino oder Ethylsulfonylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl substituiertes Phenyloxy, Phenylthio, Phenylcarbonyloxy, Phenylcarbonylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylsulfonylamino, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio steht,
- 10
- 15
- 20
- 25
- R³** für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl oder Ethyl, für Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für Cyclopropyl steht,
- 30

R⁴ für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

5 R⁵ für Hydroxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxy-carbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propyl-aminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, 10 Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Trifluormethylsulfonyl substituiertes Phenylmethoxy, Phenylcarbonyloxy, Phenylcarbonylmethoxy oder 20 Phenylsulfonyloxy steht.

Weiterhin besonders hervorgehoben seien Verbindungen der Formel (I) in denen

n, R, A, X und Z die vorstehend genannten Bedeutungen hat und

25

Y für einen gegebenenfalls durch Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, durch jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, 30

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

5 durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen,

10 durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder

15 durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyl-oxy, Benzylthio oder Benzylamino

20 substituierten 4- bis 12-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten, monocyclischen oder bicyclischen, Heterocyclus steht, welcher 1 bis 3 Stickstoffatome, eine Oxo-Gruppe und gegebenenfalls zusätzlich ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO-Gruppierung oder eine SO₂-Gruppierung, 1 oder 2 Oxo-Gruppen (C=O), 1 oder 2 Thioxo-Gruppen (C=S) oder 1 bis 3 Cyanimino-Gruppen (C=N-CN) als Bestandteile des Heterocyclus enthält und über ein Stickstoffatom mit A verknüpft ist.

25

Weiterhin besonders hervorgehoben seien Verbindungen der Formel (I) in denen

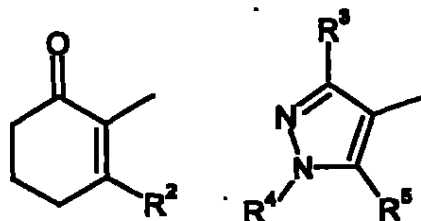
n für die Zahl 0 steht,

30 A für Methylen steht,

X für Chlor, Cyano, Methoxy, Methylsulfonyl oder Trifluormethyl steht,

Y für jeweils gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes 2-Oxo-1,3-diaza-cyclopentyl oder 2-Oxo-1,3-diaza-cyclohexyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio substituiertes Oxo-triazolinyI oder Oxo-tetrazolinyI steht, und

Z für eine der nachstehenden Gruppierungen steht



wobei

R² für Hydroxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methylsulfonylamino oder Ethylsulfonylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluomethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Trifluomethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethyl-

sulfonyl, Trifluormethylsulfonyl substituiertes Phenylloxy, Phenylthio, Phenylcarbonyloxy, Phenylcarbonylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylsulfonylamino, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio steht,

- 5 R^3 für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl oder Ethyl, für Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für Cyclopropyl steht,
- 10
- R^4 für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,
- 15 R^5 für Hydroxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Trifluormethylsulfonyl substituiertes Phenylmethoxy, Phenylcarbonyloxy, Phenylcarbonylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy steht.
- 20
- 25
- 30

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

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

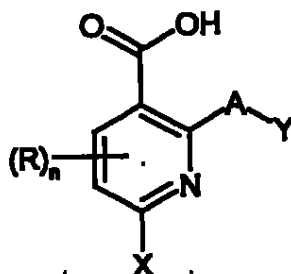
- 10 Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

- 15 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden. Außerdem können einzelne Definitionen entfallen.

- 20 Die neuen substituierten Pyridylketone der Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Pyridylketone der Formel (I), wenn man substituierte Pyridincarbonsäuren der allgemeinen Formel (II)

25



(II)

in welcher

n, A, R, X und Y die oben angegebene Bedeutung haben

- oder reaktionsfähige Derivate hiervon, wie z.B. entsprechende Säurehalogenide, Säurecyanide oder Ester -

5

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)



in welcher

10

Z die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umsetzt,

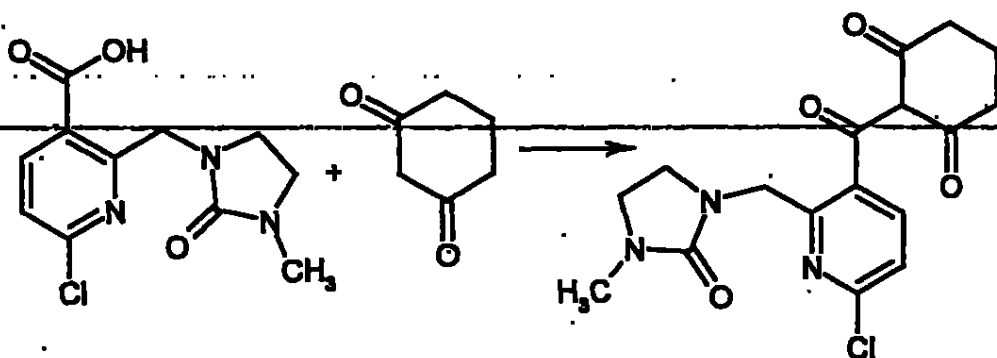
15

und gegebenenfalls im Anschluss an die Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition Folgeumsetzungen (beispielsweise Substitutions-, Oxidations- oder Reduktionsreaktionen) zur Umwandlung in andere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach üblichen Methoden durchführt.

20

Verwendet man beispielsweise 6-Chlor-2-(3-methyl-2-oxo-imidazolidin-1-yl-methyl)-nicotinsäure und Cyclohexan-1,3-dion als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skizziert werden:

25



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Pyridincarbonsäuren sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (II) haben n, A, R, X und Y vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für n, A, R, X und Y angegeben worden sind. Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind noch nicht aus der Literatur bekannt und als neue Stoffe Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Verbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (III) hat Z vorzugsweise diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für Z angegeben worden ist.

20

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannte organische Syntheschemikalien.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird vorzugsweise unter Verwendung eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel durchgeführt. Als Reaktionshilfsmittel kommen im allgemeinen die üblichen an-

25

organischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall-, -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium-, -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, N-Ethyl-piperidin, N-Methyl-morpholin, N-Ethyl-morpholin, 1,4-Diazabicyclo[2.2.2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4.3.0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-en (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines Dehydratisierungsmittels durchgeführt. Es kommen hierbei die üblichen zur Bindung von Wasser geeigneten Chemikalien in Betracht. Als Beispiele hierfür werden Dicyclohexylcarbodiimid, Carbonyl-bis-imidazol und Propanphosphonsäureanhydrid genannt, bevorzugt werden Dicyclohexylcarbodiimid und Propanphosphonsäureanhydrid.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wird vorzugsweise unter Verwendung eines oder mehrerer Verdünnungsmittel durchgeführt. Als Verdünnungsmittel kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie

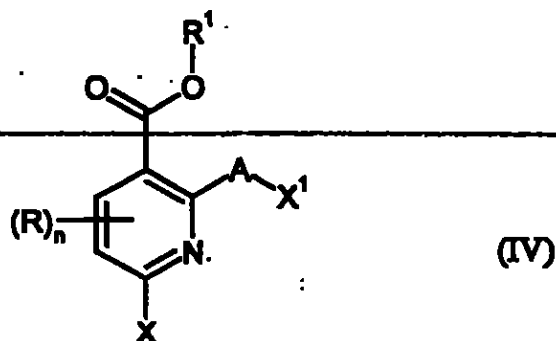
Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldi-
methyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-
keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Di-
methylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-
5 pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester
oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen
Verfahrens zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) in einem größeren Be-
10 reich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C
und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I)
wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich,
15 das erfindungsgemäße Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im all-
gemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens zur Herstellung von Ver-
bindungen der Formel (I) werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert
20 äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten
in einem größeren Überschuss zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in
einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels
durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei
der erforderlichen Temperatur geführt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen
25 Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Man erhält die neuen substituierten Pyridincarbonsäuren der allgemeinen Formel (II),
wenn man substituierte Pyridincarbonsäureester der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

n, A, R und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

R¹ für Alkyl (insbesondere Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl) oder für Arylalkyl (insbesondere für Benzyl) steht und

X¹ für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht,

10

in einem ersten Schritt mit Verbindungen der allgemeinen Formel (V)



in welcher

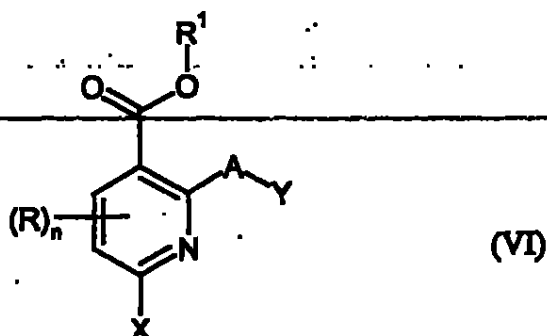
15

Y die oben angegebene Bedeutung hat und

M für Wasserstoff oder ein Metalläquivalent (insbesondere Lithium, Natrium oder Kalium) steht,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt, und die so erhaltenen Carbonsäureester der allgemeinen Formel (VI)



in einem zweiten Schritt nach üblichen Methoden, in die Carbonsäuren der Formel (II) überführt.

5

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Pyridin-carbonsäureester sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (IV) haben n , A , R , X vorzugsweise diejenige Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für n , A , R , X angegeben worden sind.

10

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (V) hat Y vorzugsweise diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für Y angegeben worden ist. Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (V) sind bekannte organische Syntheschemikalien.

15

20

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (II) wird vorzugsweise unter Verwendung eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel durchgeführt. Als Reaktionshilfsmittel kommen im allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu ge-

25

hören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall-, -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonat, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium-, -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, N-Ethyl-piperidin, N-Methyl-morpholin, N-Ethyl-morpholin, 1,4-Diazabicyclo[2.2.2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4.3.0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-en (DBU). Bevorzugt sind Natriumhydrid, Kaliumcarbonat und Triethylamin.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (II) wird vorzugsweise unter Verwendung eines oder mehrerer Verdünnungsmittel durchgeführt. Als Verdünnungsmittel kommen für den ersten Schritt vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran (THF) oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-ke-ton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid (DMF), N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid. Bevorzugt sind Acetonitril, THF und DMF. Als Verdünnungsmittel kommen für den

zweiten Schritt vor allem inerte organische Lösungsmittel und deren wässrige Mischungen in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran (THF) oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid (DMF), N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid. Bevorzugt ist THF und Mischungen aus THF und Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (II) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C, besonders bevorzugt zwischen 20°C und dem Siedepunkt des verwendeten Verdünnungsmittels.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (II) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, das erfindungsgemäße Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuss zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt.

Die Anarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt, beispielsweise durch Filtration, Umkristallisation oder Chromatographie (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die Verbindungen der Formel (VI) können entweder direkt ("in situ") zu den Verbindungen der Formel (II) umgesetzt werden oder vor der weiteren Umsetzung isoliert werden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliant, Desiccant, 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 selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

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

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: 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.

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

5

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

10

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

25

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) 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.

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 gegebenen-

falls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

5 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten
10 werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren 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
15 Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, 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
20 Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

25 Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-impregnierete 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 Dispergiernmitteln 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 erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykoether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiernmittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und 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 Phospholipide, wie Kephaleine 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-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 %.

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 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

Acetochlor, Acifluorfen (-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxymid (-sodium), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Beffubutamid, Benazolin (-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron (-methyl), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop (-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil (-allyl), Butoxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone (-ethyl), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron (-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cini-

- don (-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop (-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron (-methyl), Cloransulam (-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop (-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, Desmedipham, Diallylate, Dicamba,
- 5 Dichlorprop (-P), Diclofop (-methyl), Diclosulam, Diethatyl (-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron (-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzamid, Fenoxaprop
- 10 (-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop (-isopropyl, -isopropyl-L, -methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop (-P-butyl), Fluzolate, Flucarbazone (-sodium), Flufenacet, Flufenpyr, Flumetsulam, Flumiclorac (-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpysulfuron (-methyl, -sodium), Flurenol (-butyl), Fluridone, Fluroxypyr (-butoxypropyl, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet (-methyl), Fluthi-
- 15 amide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate (-ammonium), Glyphosate (-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop (-ethoxyethyl, -P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz (-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron (-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop,
- 20 Ketospiradox, 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, Ox-
- 25 aziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Penoxysulam, Pentoxazone, Pethoxamid, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron (-methyl), Profluzol, Profoxydim, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propoxycarbazon (-sodium), Propyzamide,
- 30 Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-ethyl), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyrifthalid,

Pyriminobac (-methyl), Pyriithiobac (-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quin-
oclamine, Quizalofop (-P-ethyl, -P-terfuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine,
Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron (-methyl), Sulfosate, Sulfosulf-
uron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbuthylazine, Terbutryn, Thienylchlor,
5 Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-methyl), Thiobencarb, Tio-
carbazon, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron (-methyl), Triclopyr, Tri-
diphane, Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron (-methyl), Tritosulfuron.

10 Für die Mischungen kommen weiterhin bekannte Safener in Frage, beispielsweise

AD-67, BAS-145138, Benoxacor, Cloquintocet (-methyl), Cyometrinil, 2,4-D, DKA-
24, Dichlormid, Dymron, Fenclorim, Fenchlorazol (-ethyl), Flurazole, Fluxofenim,
Furilazole, Isoxadifen (-ethyl), MCPA, Mecoprop (-P), Mefenpyr (-diethyl), MG-
15 191, Oxabetrinil, PPG-1292, R-29148.

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

20 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.

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

30 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.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile
5 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
10 in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically 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
15 oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit bestimmten Eigenschaften ("Traits"), die durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese, oder auch durch rekombinante DNA-Techniken erhalten worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

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
20 verwendbaren Stoffe und Mittel - auch in Kombination mit anderen agrochemischen Wirkstoffen, besseres Wachstum der Kulturpflanzen, erhöhte Toleranz der Kulturpflanzen gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz der Kulturpflanzen 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
25 30

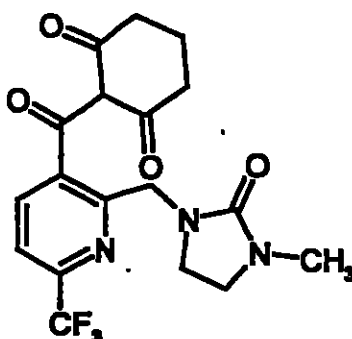
Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

- 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 auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imid-

azolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinothricin (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 Phosphinothricin, 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 allgemeinen Formel I bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden, wobei zusätzlich zu der guten Bekämpfung der Unkrautpflanzen die oben genannten synergistischen Effekte mit den transgenen Pflanzen oder Pflanzensorten auftreten. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:**Beispiel I**

5

Bine Mischung aus 1,00 g (3,63 mMol) 6-Trifluormethyl-2-(3-methyl-2-oxo-imidazolidin-1-yl-methyl)-nicotinsäure, 0,41 g (3,63 mMol) Cyclohexan-1,3-dion, 0,90 g (4,35 mMol) Dicyclohexylcarbodiimid und 30 ml Acetonitril wird 18 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Dann werden 0,75 g (7,25 mMol) Triethylamin und 0,15 g (1,45 mMol) Trimethylsilylcyanid zu dieser Mischung gegeben und die Reaktionsmischung wird 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird unter vermindertem Druck eingengt, der Rückstand mit 10%iger wässriger Natriumcarbonat-Lösung verrührt, mit Diethylether versetzt und filtriert. Die wässrige Phase des Filtrats wird abgetrennt, mit 2N-Salzsäure angesäuert und mit Methylenchlorid extrahiert. Die organische Extraktionslösung wird mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird eingengt und der Rückstand durch präparative HPLC (High Performance Liquid Chromatography) gereinigt.

20

Man erhält 0,23 g (16 % der Theorie) 2-[2-(3-Methyl-2-oxo-imidazolidin-1-yl-methyl)-6-trifluormethyl-pyridin-3-carbonyl]-cyclohexan-1,3-dion.

LogP = 2,14.

Analog zu Beispiel 1 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

5

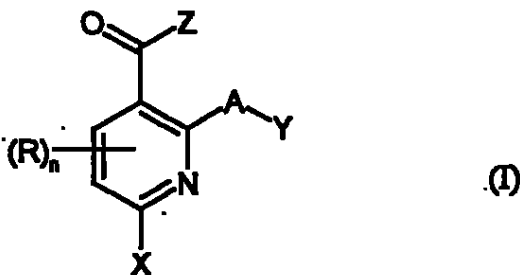
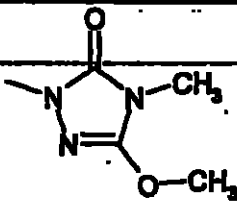
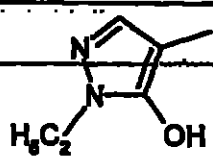
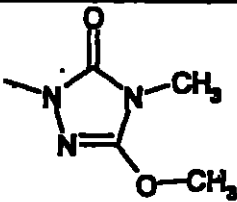
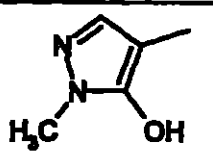
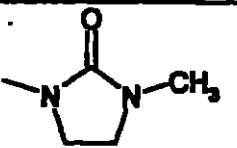
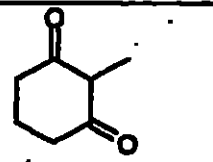
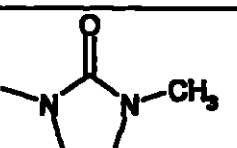
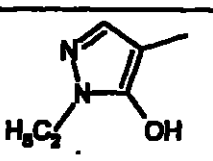
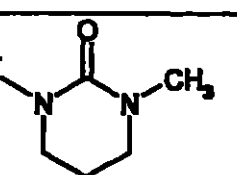
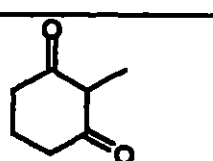
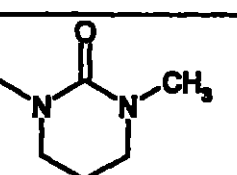
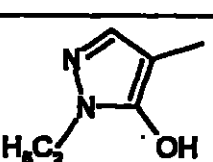
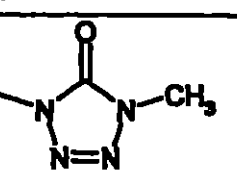
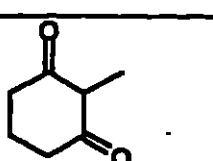
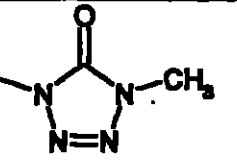
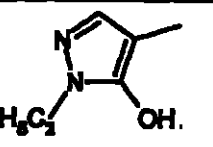
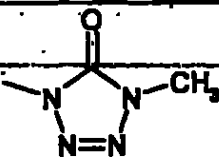
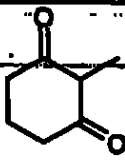
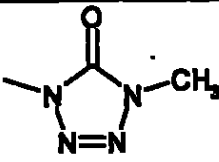
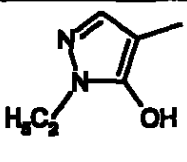
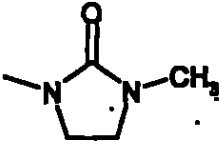
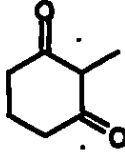
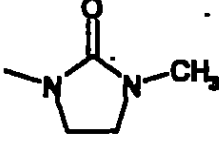
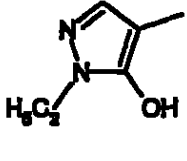
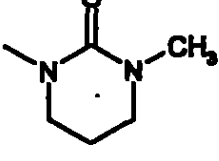
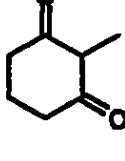
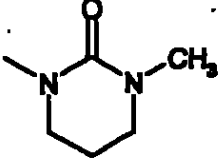
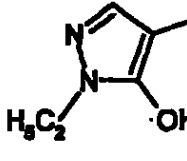
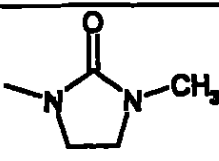
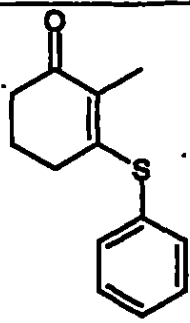


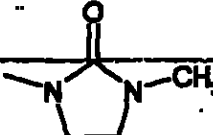
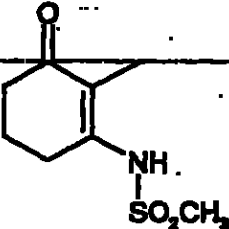
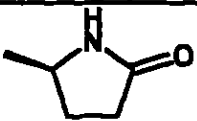
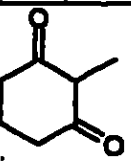
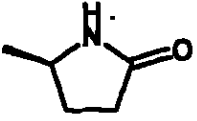
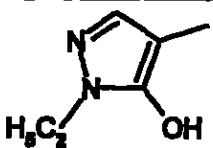
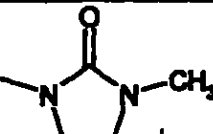
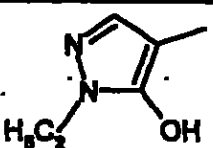
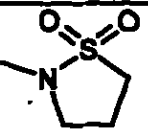
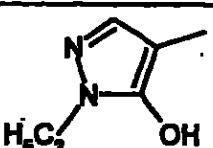
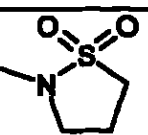
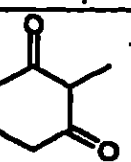
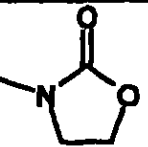
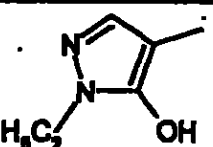
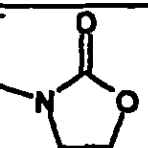
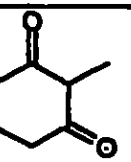
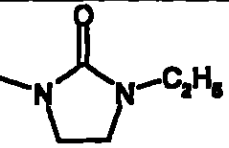
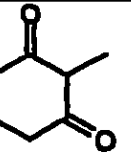
Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I).
n steht hierbei jeweils für die Zahl 0

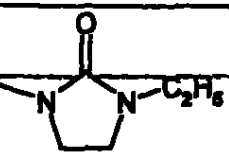
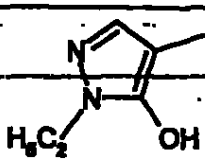
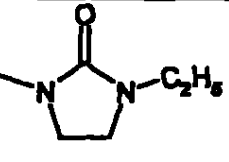
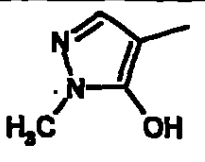
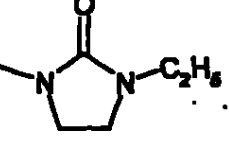
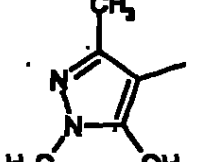
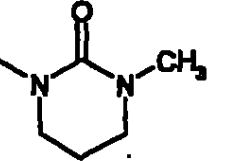
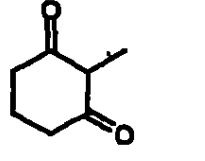
10

Bsp.-Nr.	A	X	Y	Z	Phys. Daten
2	CH ₂	CF ₃			logP=2,23 ^{a)}
3	CH ₂	CF ₃			logP=1,79 ^{a)}
4	CH ₂	CF ₃			logP=1,49 ^{a)}
5	CH ₂	CF ₃			logP=2,01 ^{a)}

Bsp.-Nr.	A	X	Y	Z	Phys. Daten
6	CH ₂	CF ₃			logP=1,59 ^{a)}
7	CH ₂	CF ₃			logP=1,36 ^{a)}
8	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
9	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
10	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
11	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
12	CH ₂	CF ₃			
13	CH ₂	CF ₃			

Bsp.-Nr.	A	X	Y	Z	Phys. Daten
14	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
15	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
16	CH ₂	OCH ₃			
17	CH ₂	OCH ₃			
18	CH ₂	Cl			
19	CH ₂	Cl			
20	CH ₂	CF ₃			

Bsp.-Nr.	A	X	Y	Z	Phys. Daten
21	CH ₂	CF ₃			
22	OCH ₂	CF ₃			logP=2,09 ^{a)}
23	OCH ₂	CF ₃			logP=1,66 ^{a)}
24	CH ₂	CF ₃			logP=1,54 ^{a)}
25	CH ₂	CF ₃			logP=1,64 ^{a)}
26	CH ₂	CF ₃			logP=2,19 ^{a)}
27	CH ₂	CF ₃			logP=1,49 ^{a)}
28	CH ₂	CF ₃			logP=1,97 ^{a)}
29	CH ₂	CF ₃			logP=2,31 ^{a)}

Bsp.-Nr.	A	X	Y	Z	Phys. Daten
30	CH ₂	CF ₃			logP=1,75 ^{a)}
31	CH ₂	CF ₃			logP=1,51 ^{a)}
32	CH ₂	CF ₃			logP=1,41 ^{a)}
33	CH ₂	CF ₃			logP=2,19 ^{a)}

Die Bestimmung der in der Tabelle angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

5

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit ^{a)} markiert.

10

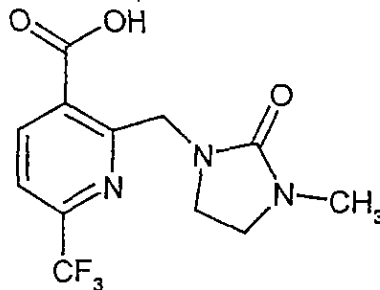
(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit ^{b)} markiert.

15

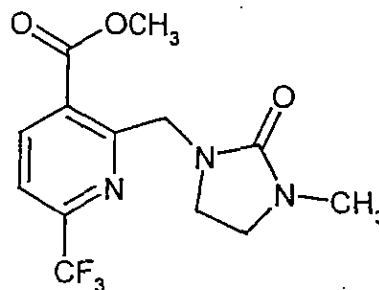
Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der

Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

5 Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Ausgangsstoffe der Formel (II):Beispiel II-1:

5

Stufe 1

10

15

Eine Mischung aus 6,2 g (62,0 mMol) 1-Methyl-2-oxo-imidazolidin, 2,5 g (62,0 mMol) Natriumhydrid und 100 ml Acetonitril wird 60 Minuten bei 80°C gerührt. Dann werden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) 18,5 g (62,0 mMol) 2-Brom-methyl-6-trifluormethyl-nicotinsäure-methylester dazu gegeben und die Reaktionsmischung wird 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend werden 100 ml Wasser vorsichtig dazu gegeben, dann mit 2N-Salzsäure angesäuert und mit Methylenchlorid geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeeengt und der Rückstand säulenchromatografisch (Kieselgel, Methylenchlorid/Acetonitril, Vol. 9:1) gereinigt.

20

Man erhält als zweite Fraktion 3,2 g (13 % der Theorie) 6-Trifluormethyl-2-(3-methyl-2-oxo-imidazolidin-1-yl-methyl)-nicotinsäure-methylester.

LogP = 1,99.

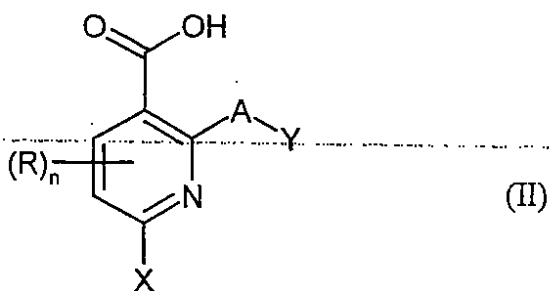
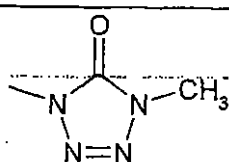
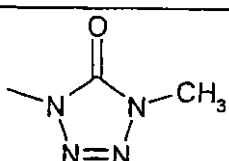
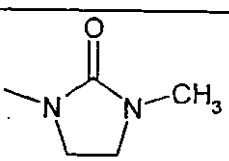
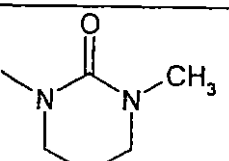
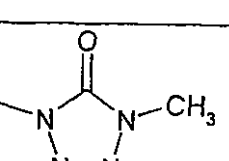
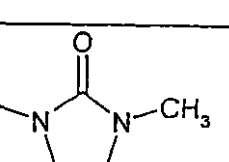
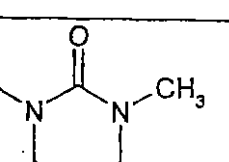
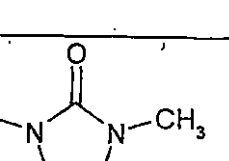
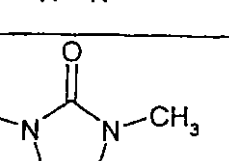
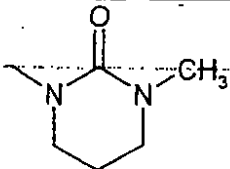
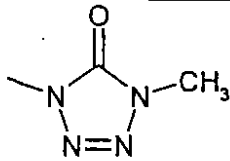
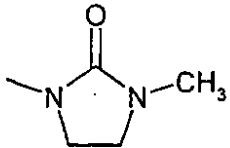
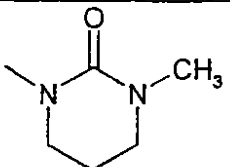
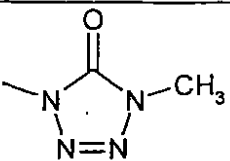
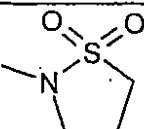
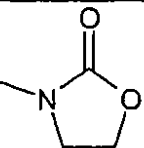
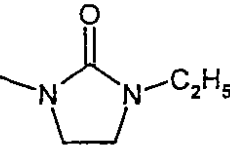


Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (II)
(n steht hierbei jeweils für die Zahl 0)

5

Bsp.-Nr.	A	X	Y	Phys. Daten
II-2	CH ₂	CF ₃		logP=1,52 ^{a)}
II-3	CH ₂	CF ₃		logP=1,72 ^{a)}
II-4	CH ₂	SO ₂ CH ₃		
II-5	CH ₂	CF ₃		logP=1,82 ^{a)}
II-6	CH ₂	SO ₂ CH ₃		

Bsp.-Nr.	A	X	Y	Phys. Daten
II-7	CH ₂	CF ₃		
II-8	CH ₂	SO ₂ CH ₃		
II-9	CH ₂	OCH ₃		
II-10	CH ₂	OCH ₃		
II-11	CH ₂	OCH ₃		
II-12	CH ₂	Cl		
II-13	CH ₂	Cl		
II-14	CH ₂	Cl		
II-15	CH ₂	CN		

Bsp.-Nr.	A	X	Y	Phys. Daten
II-16	CH ₂	CN		
II-17	CH ₂	CN		
II-18	CH ₂	CH ₃		
II-19	CH ₂	CH ₃		
II-20	CH ₂	CH ₃		
II-21	CH ₂	CF ₃		logP=1,59 ^{a)}
II-22	CH ₂	CF ₃		
II-23	CH ₂	CF ₃		logP=1,86 ^{a)}

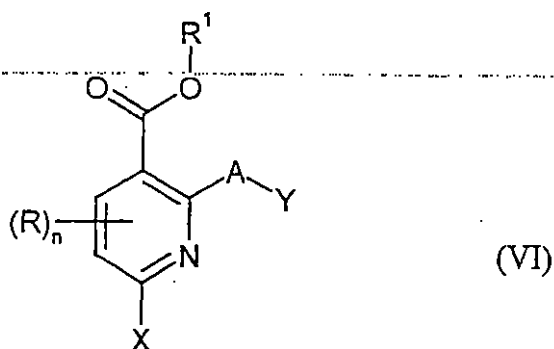
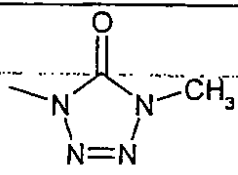
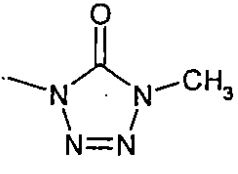
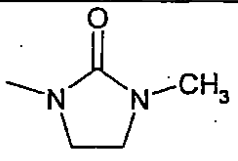
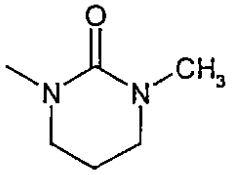
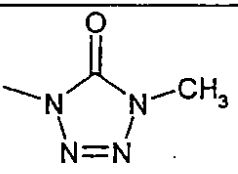
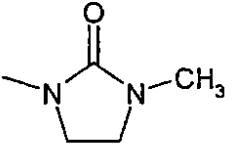
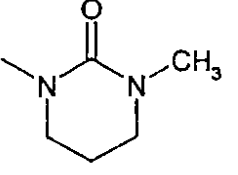
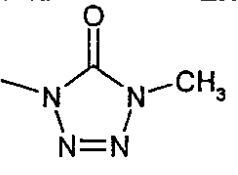
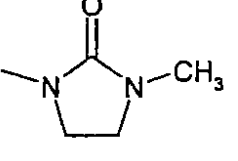
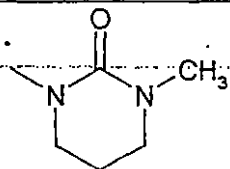
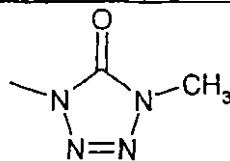
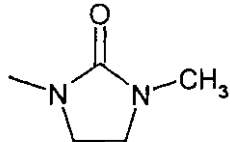
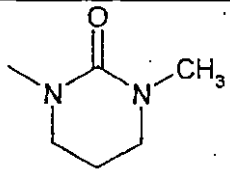
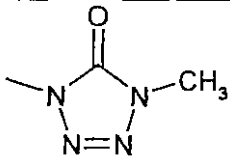
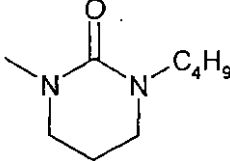
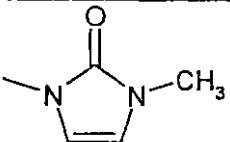
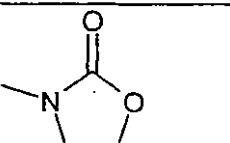
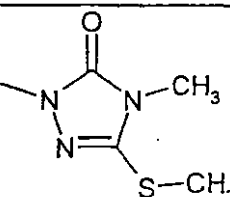
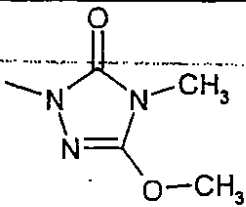
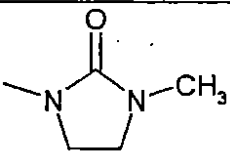
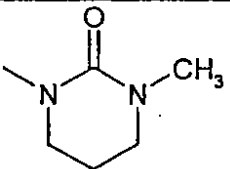
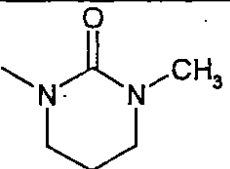
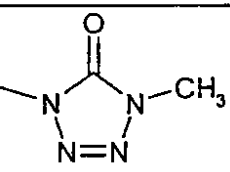
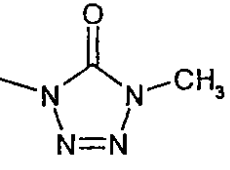
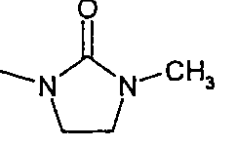
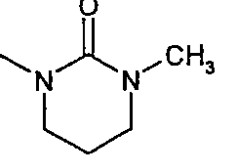
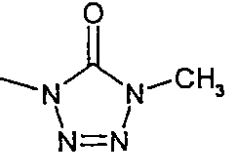


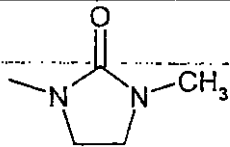
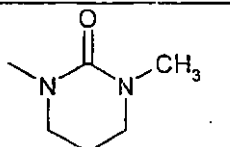
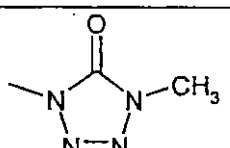
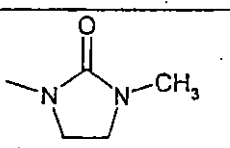
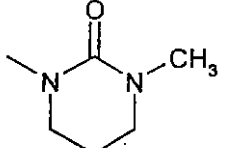
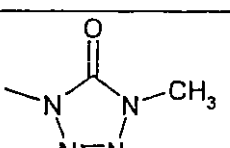
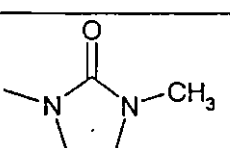
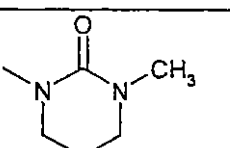
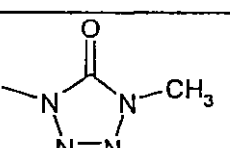
Tabelle 3: Beispiele für die Verbindungen der Formel (VI)
(n steht hierbei jeweils für die Zahl 0)

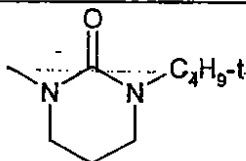
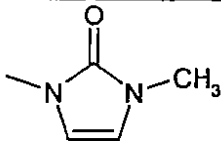
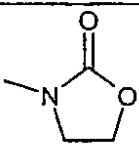
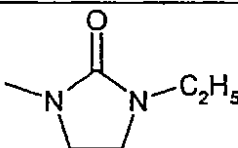
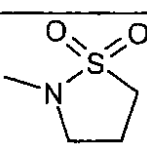
Bsp.-Nr.	A	R ¹	X	Y	Phys. Daten
VI-1	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,14 ^{a)}
VI-2	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=1,88 ^{a)}
VI-3	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		
VI-4	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-5	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		

Bsp.-Nr.	A	R ¹	X	Y	Phys. Daten
VI-6	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-7	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		
VI-8	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-9	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-10	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-11	CH ₂	CH ₃	Cl		
VI-12	CH ₂	CH ₃	Cl		
VI-13	CH ₂	CH ₃	Cl		
VI-14	CH ₂	CH ₃	CN		

Bsp.-Nr.	A	R ¹	X	Y	Phys. Daten
VI-15	CH ₂	CH ₃	CN		
VI-16	CH ₂	CH ₃	CN		
VI-17	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-18	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-19	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-20	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-21	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-22	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=1,88 ^{a)}
VI-23	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		

Bsp.-Nr.	A	R ¹	X	Y	Phys. Daten
VI-24	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-25	CH ₂	t-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-26	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-27	CH ₂	t-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-28	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-29	CH ₂	t-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-30	CH ₂	t-C ₄ H ₉	OCH ₃		
VI-31	CH ₂	t-C ₄ H ₉	OCH ₃		
VI-32	CH ₂	t-C ₄ H ₉	OCH ₃		

Bsp.-Nr.	A	R ¹	X	Y	Phys. Daten
VI-33	CH ₂	t-C ₄ H ₉	Cl		
VI-34	CH ₂	t-C ₄ H ₉	Cl		
VI-35	CH ₂	t-C ₄ H ₉	Cl		
VI-36	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CN		
VI-37	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CN		
VI-38	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CN		
VI-39	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CH ₃		
VI-40	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CH ₃		
VI-41	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CH ₃		

Bsp.-Nr.	A	R ¹	X	Y	Phys. Daten
VI-42	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-43	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-44	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-45	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,24 ^{a)}
VI-46	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,07 ^{a)}

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

5 Pre-èmergence-Test

Lösungsmittel: 5 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 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, dass die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Wirkstoffkonzentration in der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20

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

25 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
 100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 3, 4, 5 und 6 bei zum Teil guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, Soja und Weizen starke Wirkung gegen Unkräuter.

30

Beispiel BPost-emergence-Test

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

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.

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

Es bedeuten:

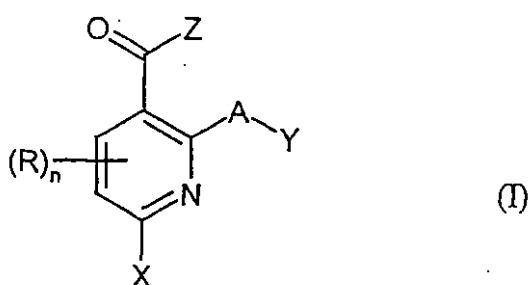
0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

25 100 % = totale Vernichtung

30 In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 3, 4 und 5 bei weitgehend guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais und Raps, starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche:

1. Verbindungen der Formel (I)



5

in welcher

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

10

A für gegebenenfalls durch O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO oder SO₂ unterbrochenes Alkandiyl oder für α- oder ω-Oxaalkandiyl, α,ω-Di-oxaalkandiyl, oder α- oder ω-Thiaalkandiyl oder α,ω-Dithiaalkandiyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

15

R für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

20

X für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

25

Y für einen gegebenenfalls durch Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen,

5

durch jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl-substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

10

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

15

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen,

20

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder

25

durch jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenylloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzylloxy, Benzylthio oder Benzylamino

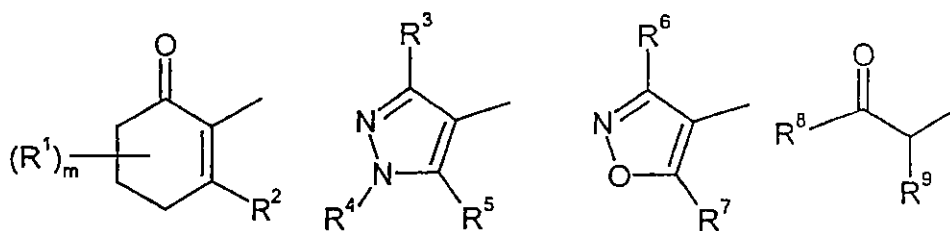
30

substituierten 4- bis 12-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten, monocyclischen oder bicyclischen, Heterocyclus, welcher 1 bis 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls zusätzlich ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO-Gruppierung oder eine SO_2 -Gruppierung, 1 bis 3 Oxo-Gruppen ($C=O$), 1 bis 3 Thioxo-Gruppen ($C=S$) oder 1 bis

3 Cyanimino-Gruppen (C=N-CN) als Bestandteile des Heterocyclus enthält, und welcher über ein Stickstoffatom mit A verknüpft ist, steht;

Z für eine der nachstehenden Gruppierungen steht

5



wobei

10

m für die Zahlen 0 bis 6 steht,

15

R^1 für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für Phenyl steht, oder -für den Fall, dass m für 2 bis 6 steht - gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R^1 für Sauerstoff oder Alkandiyl (Alkylen) mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

20

R^2 für Hydroxy, Formyloxy, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkyl-carbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy oder Alkylsulfonylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 3 bis 6

25

- 5 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl substituiertes Aryloxy, Arylthio, Arylsulfinyl, Arylsulfonyl, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylsulfonylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylsulfinyl oder Arylalkylsulfonyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für eine Gruppierung Y' - wobei Y' die oben für Y angegebene Bedeutung hat, jedoch nicht in jedem Einzelfall mit Y identisch ist - steht,
- 10
- 15 R³ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils
- 20 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 25 R⁴ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkylsulfinyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder
- 30 C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkylgruppe und

5 gegebenensfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenensfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl substituiertes Aryl oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenensfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

10

15 R⁵ für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenensfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenensfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenensfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl substituiertes Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenensfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

25

30 R⁶ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenensfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy,

30

Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

5

R⁷ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

10

R⁸ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und

15

R⁹ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

20

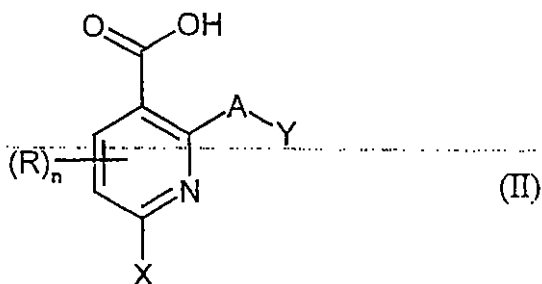
- einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze bzw. Säure- oder Basen-Addukte der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) -.

25

2. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man substituierte Pyridincarbonsäuren der allgemeinen Formel (II)

30

- 74 -



in welcher

n, A, R, X und Y die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben

5

- oder reaktionsfähige Derivate hiervon, wie z.B. entsprechende Säurehalogenide, Säurecyanide oder Ester -

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)

10



in welcher

15

Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat,

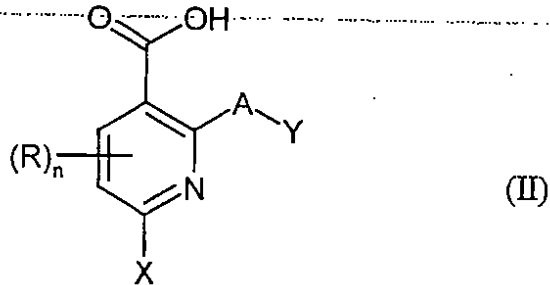
gegebenenfalls in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umsetzt,

20

und gegebenenfalls im Anschluss an die Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition Folgeumsetzungen (beispielsweise Substitutions-, Oxidations- oder Reduktionsreaktionen) zur Umwandlung in andere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach üblichen Methoden durchführt.

25

3. Verbindungen der Formel (II)

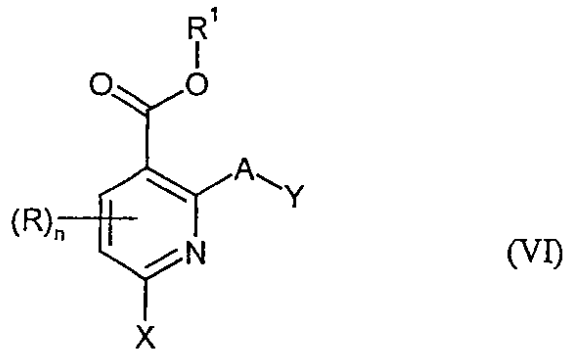


in welcher

5

n, A, R, X und Y die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

4. Verbindungen der Formel (VI)



10

in welcher

n, A, R, X und Y die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und

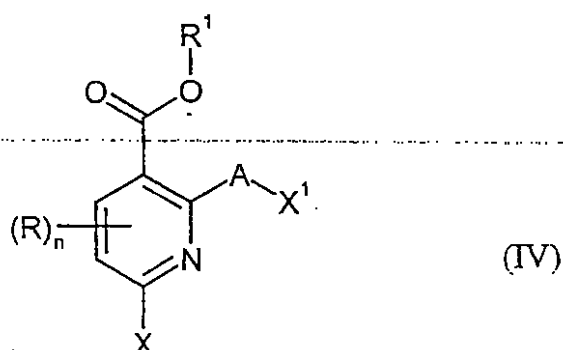
15

 R^1 für C_1 - C_4 -Alkyl oder Benzyl steht.

5. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (II) nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, dass man substituierte Pyridincarbonsäureester der allgemeinen Formel (IV)

20

- 76 -



in welcher

5 n, A, R und X die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

R^1 für Alkyl (insbesondere Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl) oder für Arylalkyl (insbesondere für Benzyl) steht und

10 X^1 für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht,

in einem ersten Schritt mit Verbindungen der allgemeinen Formel (V)



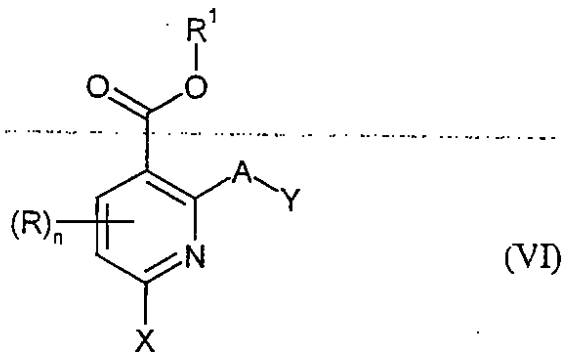
15 in welcher

Y die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat und

20 M für Wasserstoff oder ein Metalläquivalent (insbesondere Lithium, Natrium oder Kalium) steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel um-
setzt, und die so erhaltenen Carbonsäureester der allgemeinen Formel (VI)

25



in einem zweiten Schritt nach üblichen Methoden, in die Carbonsäuren der Formel (II) überführt.

5

6. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäss Anspruch 1.

10

7. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäss Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen.

15

8. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäss Anspruch 1 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.

9. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäss Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

20

10. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäss Anspruch 1 zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln.

PCT-ANTRAG

LeA 36013-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 03.04.2003 02:31:28 PM

0	Vom Anmeldeamt auszufüllen	
0-1	Internationales Akterzeichen.	
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 2.92 (aktualisiert 01.10.2002)
0-5	Antragsversuchen 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	Alterzeichen des Anmelders oder Anwalts	LeA 36013-WO
I	Bezeichnung der Erfindung	SUBSTITUIERTE PYRIDYLKETONE
II	Anmelder	
II-1	Diese Person ist	nur Anmelder
II-2	Anmelder für	Alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US
II-4	Name	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
II-5	Anschrift:	Alfred-Nobel-Str. 50 D-40789 Monheim Deutschland
II-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
II-8	Telefonnr.	0214 30 36818
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)	SCHWARZ, Hans-Georg
III-1-5	Anschrift:	Heinenbusch 19e D-40764 Langenfeld Deutschland
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

57

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)	HOISCHEN, Dorothee
III-2-5	Anschrift:	Hortensienstr. 31 D-40764 Düsseldorf 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)	KATHER, Kristian
III-3-5	Anschrift:	Stefenshovener Str. 54a D-40764 Langenfeld 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)	MÜLLER, Klaus-Helmut
III-4-5	Anschrift:	Solfstr. 19 D-40593 Düsseldorf Deutschland
III-4-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	AT
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)	DAHMEN, Peter
III-6-5	Anschrift:	Altebrücker Str. 61 D-41470 Neuss Deutschland
III-6-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-6-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

55

PCT-ANTRAG

LaA 38013-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 03.04.2003 02:31:29 PM

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)	FEUCHT, Dieter
III-7-5	Anschrift:	~~Ackerweg 9~~ Am Burggraben 7a ~~D-40780 Monheim~~ 65760 Eschborn 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)	PONTZEN, Rolf
III-8-5	Anschrift:	Am Kloster 69 D-42799 Leichlingen Deutschland
III-8-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-8-7	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 CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
IV-1-2	Anschrift:	Law and Patents, Patents and Licensing D-51368 Leverkusen Deutschland
IV-1-3	Telefonnr.	0214 30 36818
IV-1-4	Telefaxnr.	0214 30 53482

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 ZM 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 BG CH&LI CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR IE IT LU MC NL PT SE SK TR und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Europäischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist OA: BF BJ CF CG CI CM GA GN GQ 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 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 OM PH PL PT RO RU SC SD SE SG SI SK SL TJ TM TN TR TT TZ UA UG US UZ VC VN XU ZA ZM 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 and 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

57

PCT-ANTRAG

LaA 38013-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 03.04.2003 02:31:29 PM

VI-1	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht		
VI-1-1	Anmeldedatum	29 April 2002 (29.04.2002)	
VI-1-2	Nummer	10219036.4	
VI-1-3	Staat	DE	
VII-1	Gewählte internationale Recherchenbehörde	Europäisches Patentamt (EPA) (ISA/EP)	
VIII	Erklärungen	Anzahl der Erklärungen	
VIII-1	Erklärung hinsichtlich der Identität des Erfinders	-	
VIII-2	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten	1	
VIII-3	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen	1	
VIII-4	Erfindererklärung (nur im Hinblick auf die Bestimmung der Vereinigten Staaten von Amerika)	-	
VIII-5	Erklärung hinsichtlich unschädlicher Offenbarungen oder Ausnahmen von der Neuheitschädlichkeit	-	

VIII-2-1	Erklärung: Berechtigung, ein Patent zu beantragen und zu erhalten Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regeln 4.17 Ziffer II und 51bis.1 Absatz a Ziffer II), für den Fall, daß eine Erklärung nach Regel 4.17 Ziffer IV nicht einschlägig ist Name:	in bezug auf diese internationale Anmeldung BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT ist kraft des nachfolgend Aufgeführten berechtigt, ein Patent zu beantragen und zu erhalten:
VIII-2-1 (i)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, SCHWARZ, Hans-Georg
VIII-2-1 (ii)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, HOISCHEN, Dorothee
VIII-2-1 (iii)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, KATHER, Kristian
VIII-2-1 (iv)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, MÜLLER, Klaus-Helmut
VIII-2-1 (v)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, DREWES, Mark, Wilhelm
VIII-2-1 (vi)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, DAHMEN, Peter
VIII-2-1 (vii)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, FEUCHT, Dieter
VIII-2-1 (viii)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, PONTZEN, Rolf
VIII-2-1 (ix)		eine Vereinbarung zwischen BAYER AKTIENGESELLSCHAFT und BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT vom 24 Oktober 2002 (24.10.2002)
VIII-2-1 (x)	Diese Erklärung wird abgegeben im Hinblick auf:	alle Bestimmungsstaaten (mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika)

VIII-3-1	Erklärung: Berechtigung, Priorität zu beanspruchen Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, eine Priorität zu beanspruchen, in Fällen, in denen der Anmelder nicht der Anmelder der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht wird, ist oder in Fällen, in denen sich der Name des Anmelders seit dem Einreichen der früheren Anmeldung geändert hat (Regeln 4.17 Ziffer II und 51bis.1 Absatz a Ziffer II): Name:	in bezug auf diese internationale Anmeldung BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT ist kraft des nachfolgend Aufgeführten berechtigt, die Priorität der früheren Anmeldung Nr. 10219036.4 zu beanspruchen:
VIII-3-1 (II)		eine Vereinbarung zwischen BAYER AKTIENGESELLSCHAFT und BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT vom 01 April 2003 (01.04.2003).
VIII-3-1 (b)	Diese Erklärung wird abgegeben im Hinblick auf:	alle Bestimmungsstaaten

60

PCT-ANTRAG

LaA 38013-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 03.04.2003 02:31:29 PM

IX	Kontrollliste	Anzahl der Blätter	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-1	Antrag (inklusive Erklärungsblätter)	8	-
IX-2	Beschreibung	67	-
IX-3	Ansprüche	10	-
IX-4	Zusammenfassung	1	EZABST00.TXT
IX-5	Zeichnung(en)	0	-
IX-7	INSGESAMT	86	
	Beigelegte Unterlagen	Unterlage(n) in Papierform beigelegt	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-8	Blatt für die Gebührenberechnung	✓	-
IX-9	Original einer gesonderten Vollmacht		-
IX-13	Prioritätsbeleg(e)	Unterlage(n) VI-1	-
IX-17	PCT-EASY-Diskette	-	Diskette
IX-19	Nr. der Abb. der Zeichn., die mit der Zusammenf. veröffentlicht werden soll		
IX-20	Sprache der Int. Anmeldung	Deutsch	
X-1	Unterschrift des Anmelders, des Anwalts oder des Gemeinsamen Vertreters		
X-1-1	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT	

pp.a. Dr. Axel Bader, i.V. Dr. Siegfried Grimm
VOM ANMELDEAMT AUSZUFÜLLEN

10-1	Datum des tatsächlichen Eingangs dieser Internationalen Anmeldung	
10-2	Zeichnung(en):	
10-2-1	Eingegangen	
10-2-2	Nicht eingegangen	
10-3	Geänderter 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	
------	---	--

1 /

Original (para PRESENTAR) – impreso el 03.04.2003 02:31:29 AM

VIII-2-1	Declaración: Autorización para solicitar y obtener una patente Declaración con relación de la autorización del solicitante, de solicitar y obtener en el momento de la fecha de solicitud Internacional una patente (reglas 4.17 ítem II y 51bis. 1 párrafo a-ítem II), para el caso, que una declaración de acuerdo con la regla 4.17 ítem IV no sea pertinente: Nombre:	con relación a esta solicitud internacional BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT esta en poder de lo citado a continuación, autorizado para solicitar y obtener una patente:
VIII-2-1 (II)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT está autorizado como empleador del inventor, SCHWARZ, Hans-Georg
VIII-2-1 (II)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT esta autorizado como empleador del inventor, HOISCHEN, Dorothee
VIII-2-1 (II)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT esta autorizado como empleador del inventor, KATHER, Kristian
VIII-2-1 (II)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT esta autorizado como empleador del inventor, MÜLLER, Klaus-Helmut
VIII-2-1 (II)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT esta autorizado como empleador del inventor, DREWES, Mark, Wilhelm
VIII-2-1 (II)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT esta autorizado como empleador del inventor, DAHMEN, Peter
VIII-2-1 (II)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT esta autorizado como empleador del inventor, FEUCHT, Dieter
VIII-2-1 (II)		BAYER AKTIENGESELLSCHAFT esta autorizado como empleador del inventor, PONTZEN, Rolf
VIII-2-1 (III)		un acuerdo entre BAYER AKTIENGESELLSCHAFT y BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT del 24 de octubre de 2002 (24.10.2002)
VIII-2-1 (b)	Esta declaración se emite en vista de:	todos los estados designados (a excepción de los Estados Unidos de América)

VIII-3-1	Declaración: Autorización, para reivindicar prioridad Declaración con relación a la autorización del solicitante, de, en el momento de la fecha de solicitud internacional, reivindicar una prioridad, en los casos en los que el solicitante ya no sea el solicitante de la solicitud anterior, de la cual se reivindica prioridad, o en los casos, en los que el nombre del solicitante se haya modificado desde la presentación de la solicitud anterior (reglas 4.17 ítem III y 51bla. 1 párrafo a ítem II): Nombre:	con relación a esta solicitud internacional BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT esta en poder de lo citado a continuación, autorizado para reivindicar prioridad de la solicitud anterior No. 10219036.4:
VIII-3-1 (II)		un acuerdo entre BAYER AKTIENGESELLSCHAFT y BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT del 01 de abril de 2003 (01.04.2003)
VIII-3-1 (IX)	Esta declaración se emite en vista de:	todos los estados designados

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Publication No
PCT/EP 03/03948

63

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A01N43/50 A01N43/653 A01N43/54 A01N43/713 A01N43/36
A01N43/56 A01N43/78 A01N43/80 A01N43/76 C07D401/06
C07D401/14 C07D401/12

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 A01N C07D

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 00 39094 A (NOVARTIS AG (CH)) 6 July 2000 (2000-07-06) cited in the application page 1, paragraph 1 Formel (Ia), Seite 148 Verbindungen A30-B24, A62-B24, A92-B24, A122-B24, A152-B24, A182-B24 claims	1-10
X	Formel (XVId), Seite 55 Verbindungen A30, A62, A92, A122, A152, A182	3
X	Formel Xa, Seite 28	4

-/-

☒ 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.

Z document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

23 July 2003

Date of mailing of the international search report

01/08/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Cortés, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 03/03948

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
X	WO 01 54501 A (SYNGENTA AG (CH)) 2 August 2001 (2001-08-02) siehe WO 0039094 A page 1, paragraph 1 Formel (Ib), Seite 44 Formel (Id), Seite 51 Formel (Ie), Seite 55 Verbindungen A30-B24, A62-B24, A92-B24, A122-B24, A152-B24, A182-B24 Formel (Iv), Seite 200 claims	1-10
X	Formel (XVI), Seite 65 Verbindungen A30, A62, A92, A122, A152, A182	3
Y	WO 00 15615 A (NOVARTIS AG (CH)) 23 March 2000 (2000-03-23) cited in the application page 1, paragraph 1 Formel, Seite 67 Verbindung 2.045 Formel A, Seite 106 claims	1-10
Y	WO 01 94339 A (SYNGENTA AG (CH)) 13 December 2001 (2001-12-13) page 1, paragraph 1 Formeln (Ib), (IIIC), Seite 18 Formeln (A), (Q1), (Q2), (Q3); Seiten 40, 97, 102, 103 und Tabellen Verbindungen, Seiten 132-147 claims	1-10
A	WO 01 66522 A (SYNGENTA AG (CH)) 13 September 2001 (2001-09-13) cited in the application page 1, paragraph 1 Formeln (Id), (If), (Ig); Tabellen 1, 3, 4 claims	1-10
A	EP 0 791 572 A (NIPPON SODA CO LTD (JP)) 27 August 1997 (1997-08-27) cited in the application Formel, Seite 29 page 1, line 5	1-10

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/03948

64

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0039094	A	06-07-2000	AU 756636 B2	16-01-2003
			AU 2101500 A	31-07-2000
			BR 9916843 A	04-12-2001
			CA 2354387 A1	06-07-2000
			CN 1333751 T	30-01-2002
			WO 0039094 A1	06-07-2000
			EP 1140845 A1	10-10-2001
			JP 2002533443 T	08-10-2002
			US 2003040437 A1	27-02-2003
WO 0154501	A	02-08-2001	AU 3733501 A	07-08-2001
			BR 0107811 A	22-10-2002
			CA 2396587 A1	02-08-2001
			CN 1396807 T	12-02-2003
			CZ 20022547 A3	16-10-2002
			WO 0154501 A2	02-08-2001
			EP 1250047 A2	23-10-2002
WO 0015615	A	23-03-2000	AU 755721 B2	19-12-2002
			AU 5862999 A	03-04-2000
			BR 9913745 A	05-06-2001
			CA 2341291 A1	23-03-2000
			CN 1318055 T	17-10-2001
			WO 0015615 A1	23-03-2000
			EP 1114030 A1	11-07-2001
			JP 2002524554 T	06-08-2002
			US 2002016345 A1	07-02-2002
WO 0194339	A	13-12-2001	AU 6234401 A	17-12-2001
			CA 2410345 A1	13-12-2001
			CZ 20023979 A3	16-04-2003
			WO 0194339 A1	13-12-2001
			EP 1286985 A1	05-03-2003
WO 0166522	A	13-09-2001	AU 4245101 A	17-09-2001
			WO 0166522 A1	13-09-2001
EP 0791572	A	27-08-1997	AU 3815695 A	31-05-1996
			BR 9509624 A	16-09-1997
			EP 0791572 A1	27-08-1997
			US 5834404 A	10-11-1998
			CA 2204667 A1	17-05-1996
			HU 77009 A2	02-03-1998
			WO 9614285 A1	17-05-1996
			PL 320090 A1	15-09-1997

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Patentsymbol
PCT/EP 03/03948

65

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 A01N43/50 A01N43/653 A01N43/54 A01N43/713 A01N43/36
A01N43/56 A01N43/78 A01N43/80 A01N43/76 C07D401/06
C07D401/14 C07D401/12

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff: (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A01N C07D

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

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

EPO-Internal, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 00 39094 A (NOVARTIS AG (CH)) 6. Juli 2000 (2000-07-06) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Absatz 1 Formel (Ia), Seite 148 Verbindungen A30-B24, A62-B24, A92-B24, A122-B24, A152-B24, A182-B24 Ansprüche	1-10
X	Formel (XVId), Seite 55 Verbindungen A30, A62, A92, A122, A152, A182	3
X	Formel Xa, Seite 28	4

-/-

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen:

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

23. Juli 2003

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

01/08/2003

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Cortés, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Patentsymbol
PCT/EP 03/03948

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 01 54501 A (SYNGENTA AG (CH)) 2. August 2001 (2001-08-02) siehe WO 0039094 A Seite 1, Absatz 1 Formel (Ib), Seite 44 Formel (Id), Seite 51 Formel (Ie), Seite 55 Verbindungen A30-B24, A62-B24, A92-B24, A122-B24, A152-B24, A182-B24 Formel (Iv), Seite 200 Ansprüche	1-10
X	Formel (XVI), Seite 65 Verbindungen A30, A62, A92, A122, A152, A182	3
Y	WO 00 15615 A (NOVARTIS AG (CH)) 23. März 2000 (2000-03-23) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Absatz 1 Formel, Seite 67 Verbindung 2.045 Formel A, Seite 106 Ansprüche	1-10
Y	WO 01 94339 A (SYNGENTA AG (CH)) 13. Dezember 2001 (2001-12-13) Seite 1, Absatz 1 Formeln (Ib), (IIIc), Seite 18 Formeln (A), (Q1), (Q2), (Q3); Seiten 40, 97, 102, 103 und Tabellen Verbindungen, Seiten 132-147 Ansprüche	1-10
A	WO 01 66522 A (SYNGENTA AG (CH)) 13. September 2001 (2001-09-13) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Absatz 1 Formeln (Id), (If), (Ig); Tabellen 1, 3, 4 Ansprüche	1-10
A	EP 0 791 572 A (NIPPON SODA CO LTD (JP)) 27. August 1997 (1997-08-27) in der Anmeldung erwähnt Formel, Seite 29 Seite 1, Zeile 5	1-10

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die derselben Patentfamilie gehören

Internationale Zeichen

PCT/EP 03/03948

66

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0039094 A	06-07-2000	AU 756636 B2	16-01-2003
		AU 2101500 A	31-07-2000
		BR 9916843 A	04-12-2001
		CA 2354387 A1	06-07-2000
		CN 1333751 T	30-01-2002
		WO 0039094 A1	06-07-2000
		EP 1140845 A1	10-10-2001
		JP 2002533443 T	08-10-2002
WO 0154501 A	02-08-2001	US 2003040437 A1	27-02-2003
		AU 3733501 A	07-08-2001
		BR 0107811 A	22-10-2002
		CA 2396587 A1	02-08-2001
		CN 1396807 T	12-02-2003
		CZ 20022547 A3	16-10-2002
		WO 0154501 A2	02-08-2001
		EP 1250047 A2	23-10-2002
WO 0015615 A	23-03-2000	AU 755721 B2	19-12-2002
		AU 5862999 A	03-04-2000
		BR 9913745 A	05-06-2001
		CA 2341291 A1	23-03-2000
		CN 1318055 T	17-10-2001
		WO 0015615 A1	23-03-2000
		EP 1114030 A1	11-07-2001
		JP 2002524554 T	06-08-2002
WO 0194339 A	13-12-2001	US 2002016345 A1	07-02-2002
		AU 6234401 A	17-12-2001
		CA 2410345 A1	13-12-2001
		CZ 20023979 A3	16-04-2003
		WO 0194339 A1	13-12-2001
WO 0166522 A	13-09-2001	EP 1286985 A1	05-03-2003
		AU 4245101 A	17-09-2001
EP 0791572 A	27-08-1997	WO 0166522 A1	13-09-2001
		AU 3815695 A	31-05-1996
		BR 9509624 A	16-09-1997
		EP 0791572 A1	27-08-1997
		US 5834404 A	10-11-1998
		CA 2204667 A1	17-05-1996
		HU 77009 A2	02-03-1998
		WO 9614285 A1	17-05-1996
		PL 320090 A1	15-09-1997

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

67

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference LeA 36013-WO	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP2003/003948	International filing date (day/month/year) 16 April 2003 (16.04.2003)	Priority date (day/month/year) 29 April 2002 (29.04.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A01N 43/50		
Applicant BAYER CROPSCIENCE 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 <u>2</u> 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 26 August 2003 (26.08.2003)	Date of completion of this report 17 December 2003 (17.12.2003)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**International application No. PCT/EP2003/003948

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).

INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL
(Artículo 36 y Regla 70 del PCT)

Referencia del expediente del agente o solicitante LE A 36 013 -WO	PARA ACTUACIONES ADICIONALES Ver notificación de Transmisión del Reporte de Examen Preliminar (Formato PCT/IPEA416)	
Solicitud internacional No. PCT/EP03/003948	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 16 de abril de 2003	Fecha de prioridad (día/mes/año) 29 de abril de 2002
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC A01N 43/50		
Solicitante BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT		

- Este informe de examen preliminar internacional ha sido preparado por esta Administración encargada del Examen Preliminar Internacional y se envía al solicitante en concordancia con el artículo 36.
- Este **INFORME** consta de una total de 2 hojas, incluyendo la portada
☐ Este informe también se acompaña de **ANEXOS**, esto es documentos de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos que han sido corregidos y que son la base de este informe y/o documentos que contienen rectificaciones realizadas ante esta Administración (Ver Regla 70.16 y Sección 607 de las Instrucciones Administrativas según el PCT)
Estos anexos constan de un total de _____ hojas.
- Este informe contiene indicaciones relativas a los siguientes aspectos:

I	☒	Fundamentos del Informe
II	☐	Prioridad
III	☐	No se establece concepto relativo a la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial
IV	☐	Carencia de unidad de la invención
V	☒	Declaración razonada según el artículo 35(2), en relación con la novedad, nivel inventivo o aplicación industrial; citaciones y explicaciones que soportan dicha declaración
VI	☐	Ciertos documentos citados
VII	☐	Ciertos defectos de la solicitud internacional
VIII	☐	Ciertas observaciones respecto a la solicitud internacional

Fecha de presentación de la demanda 26 de agosto de 2003	Fecha de terminación de este reporte 17 de diciembre de 2003
Nombre y dirección de correo de la autoridad encargada del examen preliminar	Funcionario Autorizado Teléfono No.

70

I. Base del Informe

La base del informe de examen preliminar internacional es la solicitud de patente como se presentó originalmente.

V. Declaración motivada según la Regla 66.2(a)(II) en cuanto a la novedad, el nivel inventivo o la aplicación industrial

A la luz de los documentos citados en el informe de búsqueda internacional, se considera que la invención como se define en al menos algunas de las reivindicaciones no parece cumplir con los criterios mencionados en el artículo 33(1) del PCT, es decir, no parece ser novedosa y/o constituir un nivel inventivo (ver informe de búsqueda internacional, en particular los documentos citados con X y/o con Y y las correspondientes referencias a reivindicaciones).

-1-

PIRIDILCETONAS SUSTITUIDAS.

Campo de la invención

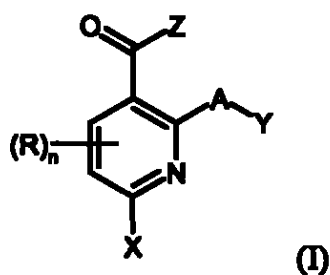
La invención se refiere a nuevas piridilcetonas sustituidas, a procedimientos para su obtención y a su empleo como agentes para el tratamiento de las plantas, especialmente como herbicidas.

Antecedentes de la invención

Se sabe ya que determinadas piridilcetonas sustituidas presentan propiedades herbicidas (véanse las publicaciones WO-A-01/66522, WO-A-00/39094, WO-A-00/15615, WO-A-96/17829, WO-A-96/14285 / EP-A-791572, WO-A-93/01171 / EP-A-641780, JP-A-04029973 - citada en Chem. Abstracts 116:230216, JP-A-03052862 - citada en Chem. Abstracts 115:226166, WO-A-91/00260 / EP-A-432275, JP-A-03038586 - citada en Chem. Abstracts 115:29323). Sin embargo, el efecto de estos compuestos no es satisfactorio desde todos los puntos de vista.

Descripción detallada de la invención

Se han encontrado ahora nuevas piridilcetonas sustituidas de la fórmula (I)



en la que

- n significa los números 0, 1 o 2;
- A significa alcanodiilo interrumpido, en caso dado, por O (oxígeno), S (azufre), SO o SO₂ o significa α- u ω-oxaalcanodiilo, α, ω-dioxaalcanodiilo o α- u ω-tialcanodiilo o α,ω-ditialcanodiilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono;

-2-

- R** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos, respectivamente, en caso dado por
- 5** ciano, por hidroxí, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono;
- X** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos, respectivamente, en caso dado por
- 10** ciano, por hidroxí, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono;
- Y** significa un heterociclo con 4 hasta 12 miembros, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, que contiene como parte integrante del heterociclo desde 1 hasta 4 átomos de nitrógeno y, en caso dado, además, un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un agrupamiento SO- o un agrupamiento SO₂-, 1 hasta 3 grupos oxo (C=O), 1 hasta 3 grupos tioxo (C=S) o 1 hasta 3 cianoimino (C=N-CN),
- 15** enlazado a través de un átomo de nitrógeno con A, substituido en caso dado por hidroxí, por mercapto, por ciano, por halógeno,
- por alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos
- 20** alquilo, substituidos, respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- por alquilamino o dialquilamino con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de
- 25** carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno,

-3-

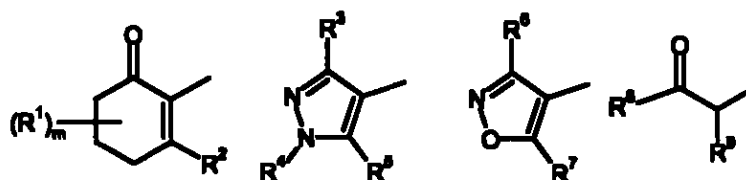
por alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno,

5 por cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos, respectivamente, en caso dado, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o

10 por fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos, respectivamente, en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

y

Z significa uno de los agrupamientos siguientes



15

donde

m significa los números 0 hasta 6,

R¹ significa halógeno, significa alquilo o alquiltio con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenilo, o -en el caso en que m signifique 2 hasta 6- significa en caso dado también junto con un segundo resto R¹, oxígeno o alcanodiilo (alquileno) con 2 hasta 5 átomos de carbono,

20

-4-

- R²** significa hidroxí, formiloxi, halógeno, significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi o alquilsulfonilamino con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alqueniloxi o alquiniloxi con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente, en caso dado por halógeno, significa ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilsulfonilamino, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, 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, 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 alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa un agrupamiento Y' -donde Y' tiene el significado indicado anteriormente para Y, sin embargo no es idéntico con Y en cada caso particular-,
- R³** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcóxicarbonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos, respectivamente, en caso dado por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi

- con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- 5 **R⁴** significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente, en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, 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, 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 alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- 10
- 15
- 20
- 25 **R⁵** significa hidroxí, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcovicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi con, respectivamente, 1 hasta 6

-6-

- átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso
 dado, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por
 alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquini-
 lo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente,
 5 en caso dado por ciano o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarbonilo,
 arilcarbonilalcoxi o arilsulfonilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de
 carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la
 parte alquilo, substituidos, respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano,
 por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con
 10 1 a 4 átomos de carbono, 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 alquilsulfonilo
 con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de
 carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por
 15 halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono;
- R⁶ significa hidrógeno, ciano, carbamilo, tiocarbamilo, halógeno, o significa
 alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfonilo o
 alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos
 respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4
 20 átomos de carbono,
- R⁷ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono
 substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos
 de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido,
 en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- 25 R⁸ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono
 substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos

-7-

de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, y

- R⁹ significa hidrógeno, ciano, carbamilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, -con inclusión de todas las posibles formas tautómeras de los compuestos de la fórmula general (I) y de las posibles sales o bien aductos con ácidos o con bases de los compuestos de la fórmula general (I)-.

En las definiciones anteriores y siguientes son válidas, en tanto en cuanto no se diga otra cosa, las definiciones siguientes:

- Las cadenas hidrocarbonadas saturadas o insaturadas, tales como alquilo, alcanodiilo, alquenilo o alquínilo, incluso en combinación con heteroátomos, tal como por ejemplo en alcoxi, alquiltio o alquilamino, son, respectivamente, de cadena lineal o de cadena ramificada. En tanto en cuanto no se diga otra cosa son preferentes las cadenas hidrocarbonadas con 1 hasta 6 átomos de carbono.

- Cicloalquilo significa compuestos saturados, carbocíclicos, que forman, en caso dado, con otros anillos carbocíclicos, sobrecondensados o puenteados, un sistema anular policíclico. Son preferentes, en tanto en cuanto no se diga otra cosa, ciclopropilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

Ariilo significa anillos hidrocarbonados aromáticos, mono- o policíclicos, tales como por ejemplo fenilo, naftilo, antranilo, fenantrilo, preferentemente fenilo o naftilo, especialmente fenilo.

- Heterociclilo significa compuestos saturados, insaturados o aromáticos, anulares, en los cuales al menos un miembros del anillo es un heteroátomo, es decir un átomo

-8-

diferente de carbono. Cuando el anillo contenga varios heteroátomos, éstos pueden ser iguales o diferentes. Los heteroátomos preferentes son oxígeno, nitrógeno o azufre. Cuando el anillo contenga varios átomos de oxígeno, éstos no serán contiguos. En caso
 5 dado los compuestos anulares forman junto con otros anillos carbocíclicos o heterocíclicos, sobrecondensados o puenteados, un sistema anular policíclico. Un sistema anular policíclico puede estar enlazado a través del anillo heterocíclico o a través de un anillo carbocíclico sobre-condensado. Son preferentes los sistemas anulares monocíclicos o bicíclicos, especialmente los sistemas anulares monocíclicos con 5 o 6 miembros en el anillo y los sistemas anulares bicíclicos con 7 hasta 9 miembros en el
 10 anillo.

Los compuestos según la invención, de la fórmula general (I), contienen en caso
 dado uno o varios átomos de carbono substituidos de manera asimétrica y, por lo tanto, pueden presentarse en diversas formas enantiómeras (con la configuración R y S) o bien diastereómeras. La invención se refiere tanto a las diversas formas enantiómeras o bien
 15 estereoisómeras individuales posibles de los compuestos de la fórmula general (I) así como también a las mezclas de estos compuestos estereoisómeros.

Los substituyentes preferentes o bien los intervalos preferentes de los restos presentes en las fórmulas anteriores y que se indicarán a continuación, se definen seguidamente.

20 Preferentemente,
 n significa los números 0 o 1.
 Preferentemente,
 A significa alcanodiilo interrumpido por O, SO o SO₂ o significa α - u ω -oxaalcanodiilo, α,ω -dioxaalcanodiilo, α - u ω -trialcanodiilo o α -, ω -
 25 ditiaalcanodiilo con, respectivamente, 1 hasta 4 átomos de carbono.
 Preferentemente,

-9-

- R** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.
- 5 Preferentemente,
- X** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.
- 10 Preferentemente,
- Y** significa un heterociclo con 4 hasta 12 miembros, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, que contiene de 1 hasta 4 átomos de nitrógeno y, en caso
- 15 dado, además un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un agrupamiento SO- , un agrupamiento SO_2- , 1 o 2 grupos oxo (C=O), grupos tioxo (C=S) o grupos cianoimino (C=N-CN) como parte integrante del heterociclo y que está enlazado a través de un átomo de nitrógeno con A, substituido en caso dado,
- por hidroxí, por mercapto, por ciano, por halógeno,
- 20 por alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4
- 25 átomos de carbono,

-10-

por alquilamino o dialquilamino con, respectivamente, hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno,

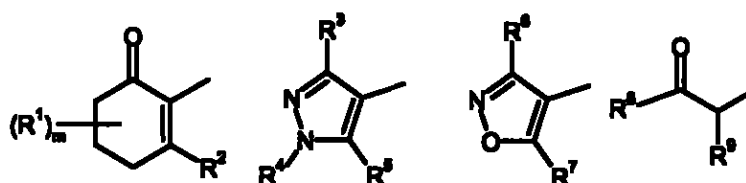
5 por alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino con, respectivamente, hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno,

10 por cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o

15 por fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos, respectivamente, en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

Z significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

20 m significa los números 0 hasta 5,

R¹ significa halógeno, significa alquilo o alquiltio con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por

-11-

- alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenilo, o -en el caso en que m signifique 2 hasta 5- significa en caso dado también junto con un segundo resto R^1 , oxígeno o alcanodiilo (alquileo) con 2 hasta 4 átomos de carbono,
- R^2 significa hidroxilo, formiloxi, halógeno, significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi o alquilsulfonilamino con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxilo, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenoiloxi o alquinoiloxi con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno, significa ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilsulfonilamino, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, 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, 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 alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoal-quilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa un agrupamiento Y' -teniendo Y' el significado indicado anteriormente para Y de manera preferente, sin embargo no es idéntico a Y en cada caso particular-,

-12-

R³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcóxicarbonilo con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

10 R⁴ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 5 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo con, respectivamente, 3 hasta 5 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, 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, 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 alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4

-13-

átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁵ significa hidroxilo, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi con, respectivamente, 1 hasta 5

5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alqueniloxi o alquiniloxi con, respectivamente, 3 hasta 5 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi,

10 arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, 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, 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 alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

20 **R⁶** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

25 **R⁷** significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 5 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos

- de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- R⁸** significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 5 átomos de carbono, substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos
- 5** de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono, substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, y
- R⁹** significa hidrógeno, ciano, carbamilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1
-  **10** hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.
- De forma especialmente preferente,
- n** significa el número 0.
- De forma especialmente preferente,
- 15 A** significa alcanodiilo interrumpido, en caso dado, por O, S, SO o SO₂ o significa α - u ω -oxaalcanodiilo o α - u ω -tiaalcanodiilo con, respectivamente, 1, 2 o 3 átomos de carbono.
- De forma especialmente preferente,
- R** significa nitro, ciano, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o
- 20** dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 3 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono.
- De forma especialmente preferente,
- 25 X** significa nitro, ciano, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o

dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 3 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

- 5 Y significa un heterociclo con 4 hasta 12 miembros, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, enlazado a través de N (1 átomo de nitrógeno) con A, que contiene como parte integrante del heterociclo de 1 hasta 4 átomos de nitrógeno y, en caso dado, además un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un agrupamiento SO-, un agrupamiento SO₂-, 1 o 2 grupos oxo (C=O), 1 o 2 grupos tioxo (C=S), o un grupo cianoimino (C=N-CN) substituido en caso dado
- 10 por ciano, por halógeno,
por alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado por ciano, por halógeno, por
- 15 alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono,
por alquilamino o dialquilamino con, respectivamente, hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por
- 20 halógeno,
por alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino con, respectivamente, hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado por halógeno,
por cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquil-
- 25 alquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquiltio o cicloalquilalquilamino con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en

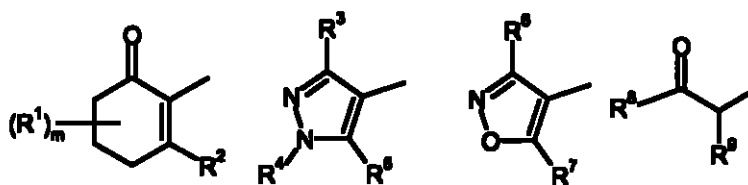
-16-

caso dado, 1 hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, o

5 por fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

Z significa uno de los agrupamientos siguientes



10 donde

m significa los números 0 hasta 4,

15 R^1 significa halógeno, significa alquilo o alquiltio con, respectivamente, 1 hasta 4 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono, o significa fenilo, o -en el caso en que m signifique de 2 hasta 5- significa en caso dado también junto con un segundo resto R^1 , oxígeno o alcanodiilo (alquileno) con 2 o 3 átomos de carbono,

20 R^2 significa hidroxí, formiloxi, halógeno, significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcovicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi o alquilsulfonilamino con, respectivamente, 1 hasta 4 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono o por alquilsulfonilo

-17-

- con 1 a 3 átomos de carbono, significa alqueniloxi o alquiniloxi con, respectivamente, 3 hasta 5 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno, significa ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilsulfonilamino, arilalcoxi,
- 5 arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 o 2 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por
- 10 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 alquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono, o significa un
- 15 agrupamiento Y' -teniendo Y' el significado indicado anteriormente para Y como especialmente preferente, sin embargo no es idéntico a Y en cada caso particular-
- R³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcóxicarbonilo con,
- 20 respectivamente, 1 hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono
- 25 substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono,

-18-

- R⁴** significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo con, respectivamente, 3 o 4 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 o 2 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, 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 alquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono,
- R⁵** significa hidroxí, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxycarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi con, respectivamente, 1 hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 3 átomos de carbono, significa alqueniloxi o alquiniloxi con, respectivamente, 3 o 4 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi,

- arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 o 2 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, 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 alquil-sulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 3 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 3 átomos de carbono,
- 10 **R⁶** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 4 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono,
- 15 **R⁷** significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono,
- 20 **R⁸** significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, y
- 25 **R⁹** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1

hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono.

De forma muy especialmente preferente,

- 5 A significa metileno, etano-1,2-diilo (dimetileno), 1-oxa-etano-1,2-diilo, 2-oxa-etano-1,2-diilo, 1-tia-etano-1,2-diilo, 2-tia-etano-1,2-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo (trimetileno), 1-oxa-propano-1,3-diilo, 2-oxa-propano-1,3-diilo, 3-oxa-propano-1,3-diilo, 1-tia-propano-1,3-diilo o 3-tia-propano-1,3-diilo.

De forma muy especialmente preferente,

- 10 R significa nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi o etoxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, dimetilamino o dimetilsulfonilo.

- 15 De forma muy especialmente preferente,

- 20 X significa nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi o etoxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, dimetilamino o dimetilaminosulfonilo.

De forma muy especialmente preferente,

- 25 Y significa un heterociclo enlazado a través de nitrógeno con A, elegido de la serie formada por pirrolidinilo, oxopirrolidinilo, pirrolilo, indolilo, pirazolilo, imidazolilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, oxoimidazolinilo, 2-oxo-1,3-diaza-ciclopentilo, 2-oxo-1,3-diaza-ciclopentenilo, oxazolidinilo, 2-oxo-1,3-oxoza-

-21-

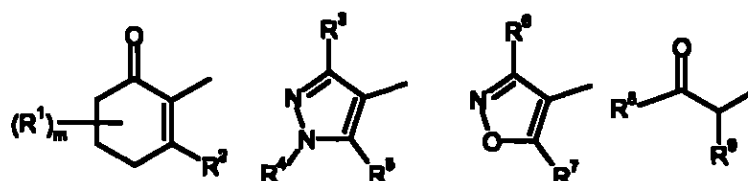
- ciclopentilo (2-oxo-oxazolidinilo), 1,2-oxoaza-ciclopentilo (isoxazolidinilo), 1,2-oxoaza-ciclohexilo, tiazolidinilo, cianoiminotiazoli-dinilo, oxotriazolinilo, tioxotriazolinilo, oxotetrazolinilo, piperidinilo, oxo-piperidinilo, 2-oxo-1,3-diaza-ciclohexilo, 2-oxo-1-aza-cicloheptilo, 2-oxo-1,3-diaza-cicloheptilo, morfolinilo,
- 5 piperazinilo, substituidos en caso dado por ciano, flúor, cloro, bromo, por metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-buti-roilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo, substituidos respectivamente, en caso dado por
- 10 ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, por metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor y/o por cloro, por etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo, butinilo, propeniloxi,
- 15 buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propenilamino o butenilamino, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro y/o por bromo, por ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentil-amino,
- 20 ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilmetiltio, ciclobutilmetiltio, ciclopentilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilmetiltio, ciclobutilmetil-amino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino, substituidos respectivamente, en
- 25 caso dado, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo, o por fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o

-22-

bencilamino, substituidos respectivamente, en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi.

De forma muy especialmente preferente,

5 Z significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m significa los números 0 hasta 3,

10 R¹ significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, substituidos, respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, o significa fenilo, o -en el caso en que m signifique 2 o 3- en caso dado también junto con un segundo resto R¹, significa oxígeno, metileno o dimetileno (etano-
15 1,2-diilo),

20 R² significa hidroxilo, cloro, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, metilsulfonilamino o etilsulfonilamino, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi, butiniloxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro y/o por bromo, significa feniloxi, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo,

-23-

- fenilcarboniloxi, fenilcarbonilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilsulfonilamino, fenilmetoxi, fenil-metiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo, substituídos respectivamente, en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por difluórmtilo, por trifluórmtilo, por clorodifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmtoxi, por trifluórmtoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por difluórmtiltio, por trifluórmtiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por trifluórmtilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por trifluórmtilsulfonilo,
- 10 R^3 significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, substituídos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo, substituídos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo,
- 15 R^4 significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, substituídos respectivamente, en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo, substituídos respectivamente, en caso dado por ciano, por flúor, por cloro y/o por bromo, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, substituídos respectivamente, en caso dado,
- 20
- 25

- por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o fenilmetilo, substituídos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi, por trifluórmétoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por trifluórmétiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por trifluórmétilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo o por trifluórmétilsulfonilo,
- R⁵ significa hidroxí, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butirolí, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi, substituídos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxi-carbonilo, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi, substituídos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxi, fenilcarboniloxi, fenilcarbonilmetoxi o fenilsulfoniloxi, substituídos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi, por trifluórmétoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por trifluórmétiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por trifluórmétilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo o por trifluórmétilsulfonilo,
- R⁶ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolí, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo, substituídos

respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

5 R^7 significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, substituidos respectivamente, en caso dado; por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo,

10 R^8 significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, y

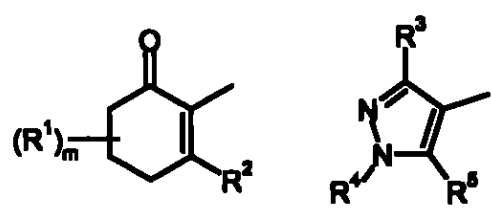
15 R^9 significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi.

Deben señalarse especialmente los compuestos de la fórmula (I)

en la que

20 n, A, X e Y tienen los significados anteriormente indicados y

Z significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

- m significa los números 0 hasta 3,
- R¹ significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metiltio, etiltio, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo,
- 5 R² significa hidroxí, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, metilsulfonilamino o etilsulfonilamino, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi, butiniloxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor y/o por cloro, significa
- 10 feniloxi, feniltio, fenilcarboniloxi, fenilcarbonilmetoxi, fenilsulfo-niloxi, fenilsulfonilamino, fenilmetoxi, fenilmetiltio, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por difluórmétoxi, por trifluórmétoxi, por metiltio, por etiltio, por trifluórmétiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por trifluór-metilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por trifluórmétilsulfonilo,
- 15 R³ significa hidrógeno, significa metilo o etilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, o significa
- 20
- 25

ciclopropilo,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo,

R⁵ significa hidroxilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n-

5 o i-propoxi, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxi-carbonilo, significa acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi, significa propenil-oxi, buteniloxi,

10 propiniloxi o butiniloxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxi, fenilcarboniloxi, fenilcarbonilmetoxi o fenilsulfoniloxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluormetilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluormetoxi, por trifluormetoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por trifluormetiltio, por metil-sulfinilo, por etilsulfinilo, por trifluormetilsulfinilo, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo o por trifluormetilsulfinilo.

Además deben señalarse especialmente los compuestos de la fórmula (I), en los que

20 n, R, A, X y Z tienen los significados anteriormente indicados y

Y significa un heterociclo con 4 hasta 12 miembros, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, que contiene, como parte integrante del heterociclo de 1 hasta 3 átomos de nitrógeno, un grupo oxo y, en caso dado, además un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un agrupamiento SO- o un agrupamiento SO₂, 1 o 25 2 grupos oxo (C=O), 1 o 2 grupos tioxo (C=S) o 1 hasta 3 grupos cianoimino (C=N-CN) y que está enlazado a través de un átomo de nitrógeno con A,

-28-

substituido en caso dado por

hidroxi, mercapto, ciano, halógeno,

por alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos, respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

10 por alquilamino o dialquilamino con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno,

por alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino con, respectivamente 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno,

15 por cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o

20 por fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Además debe señalarse especialmente los compuestos de la fórmula (I) en los

25 que

n significa el número 0,

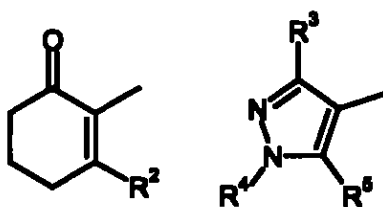
-29-

A significa metileno,

X significa cloro, ciano, metoxi, metilsulfonilo o trifluormetilo,

Y significa 2-oxo-1,3-diaza-ciclopentilo o 2-oxo-1,3-diaza-ciclohexilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, o significa oxo-triazolinilo ù oxo-tetrazolinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por metilo, por etilo, por metoxi, por etoxi, por metiltio o por etiltio, y

Z significa uno de los agrupamientos siguientes



10 donde

R² significa hidroxilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilamino-carboniloxi, metilsulfo-niloxi, etilsulfoniloxi, metilsulfonilamino o etilsulfonilamino, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi, butiniloxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor y/o por cloro, significa feniloxi, feniltio, fenilcarboniloxi, fenilcarbonilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilsulfonilamino, fenilmetoxi, fenilmetiltio, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluormetilo, por metoxi, por etoxi, por difluormetoxi, por trifluormetoxi, por metiltio, por etiltio, por trifluormetiltio, por

metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por trifluor-metilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por trifluormetilsulfonilo,

R³ significa hidrógeno, significa metilo o etilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, o significa ciclopropilo,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo,

10 R⁵ significa hidroxí, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, significa acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi, significa propenil-oxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxi, fenilcarboniloxi, fenilcarbonilmetoxi o fenilsulfoniloxi, substituidos respectivamente, en caso

15

20 dado, por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluormetilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluormetoxi, por trifluormetoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por trifluormetiltio, por metil-sulfinilo, por etilsulfinilo, por trifluormetilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo o por trifluormetilsulfonilo.

25 Según la invención son preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente como

preferentes.

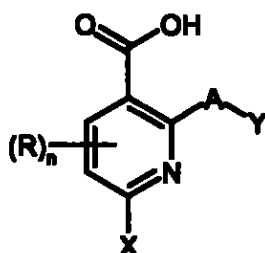
Según la invención son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente como especialmente preferentes.

5 Según la invención son muy especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente como muy especialmente preferentes.

Las definiciones de los restos indicadas anteriormente de manera general o en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) así como, de manera correspondiente, para los productos de partida para los productos intermedios necesarios, respectivamente, para la obtención. Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos preferentes indicados. Además pueden no estar presentes definiciones particulares.

15 Las nuevas piridilcetonas substituidas de la fórmula (I) se caracterizan por una actividad herbicida potente y selectiva.

Se obtienen las nuevas piridilcetonas substituidas de la fórmula (I), si se hacen reaccionar ácidos piridincarboxílicos, substituidos, de la fórmula general (II)



(II)

en la que

20 n, A, R, X e Y tienen el significado anteriormente indicado

-o derivados reactivos de los mismos, tales como por ejemplo los halogenuros de acilo, las cianidas de acilo o los ésteres correspondientes-
con compuestos de la fórmula general (III)

en la que

Z tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente deshidratante así como, en caso dado, en

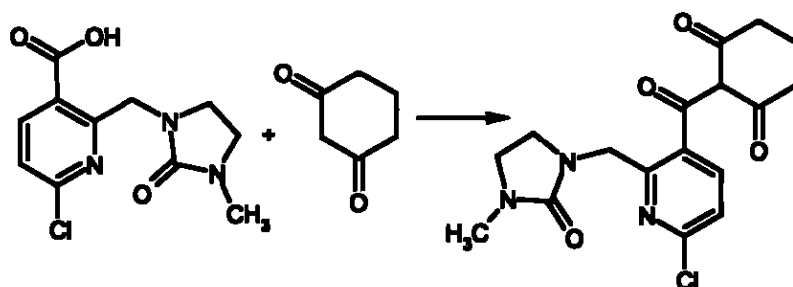
5 presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

y, en caso dado, después de la realización del procedimiento según la invención se llevan a cabo, según métodos usuales, en los compuestos obtenidos de este modo, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los substituyentes, reacciones

10 subsiguientes (por ejemplo reacciones de substitución, de oxidación o de reducción) para su transformación en otros compuestos de la fórmula general (I).

Si se emplean, por ejemplo, el ácido 6-cloro-2-(3-metil-2-oxo-imidazolidin-1-il-metil)-nicotínico y la ciclohexano-1,3-diona como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento según la

15 invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Los ácidos piridincarboxílicos substituidos, a ser empleados como productos de partida en el caso del procedimiento según la invención, para la obtención de los

20 compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), n, A, R, X e Y tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente, de manera

especialmente preferente, de manera muy especialmente preferente o en el caso mas preferente para n, A, R, X e Y en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula general (I). Los productos de partida de la fórmula general (II) no son todavía conocidos por la literatura y constituyen, a modo de nuevos productos, un
5 objeto de la presente solicitud.

Los compuestos a ser empleados además como productos de partida en el caso del procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (III). En la fórmula general (III), Z tiene, preferentemente, el significado que ya ha sido indicado
10 anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente, de manera muy especialmente preferente, o en el caso mas preferente para Z, en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula general (I).

Los productos de partida de la fórmula (III) son productos químicos orgánicos para síntesis, conocidos.

15 El procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se lleva a cabo, preferentemente, en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción. Como agentes auxiliares de la reacción para el procedimiento según la invención entran en consideración, en general, las bases o aceptores de ácido inorgánicos u orgánicos usuales. A estos pertenecen,
20 preferentemente, acetatos, amidas, carbonatos, bicarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcanolatos de metales alcalinos o de metales alcalino-térreos tales como, por ejemplo, acetato de sodio, de potasio o de calcio, amida de litio, de sodio, de potasio o de calcio, carbonato de sodio, de potasio o de calcio, bicarbonato de sodio, de potasio o de calcio, hidruro de litio, de sodio, de potasio o de calcio, hidróxido de litio, de sodio, de potasio
25 o de calcio, metanolato, etanolato, n- o i-propanolato, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o de potasio, además, también compuestos orgánicos básicos nitrogenados tales como, por

ejemplo, trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, dicitclohexilamina, etil-dicitclohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-
 5 piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabicyclo[2,2,0]-octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo, [4,3,0]-non-5-eno (DBN), y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-eno (DBU).

El procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo, preferentemente, con empleo de un agente deshidratante. En este caso entran en consideración los productos químicos usuales, adecuados para
 10 enlazar agua. Como ejemplos a este respecto pueden citarse dicitclohexilcarbodiimida, carbonil-bis-imidazol y anhídrido del ácido propanofosfónico, serán preferentes la dicitclohexilcarbodiimida y el anhídrido del ácido propanofosfónicos.

El procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se llevará a cabo, preferentemente, con empleo de uno o varios
 15 diluyentes. Como diluyentes para la realización del procedimiento según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, especialmente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo,
 20 tetracloruro de carbono; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, o etilenglicoldimetil- o -dietiléter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo o butironitrilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato
 25 de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos tal como dimetilsulfóxido.

Las temperaturas de la reacción, en la realización del procedimiento según la

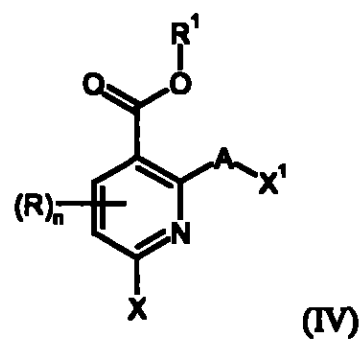
105

invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C, y preferentemente a temperaturas comprendidas entre 10°C y 120°C.

5 El procedimiento según la invención se lleva a cabo, en general, a presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo el procedimiento según la invención a presión mas elevada o bajo presión mas reducida - en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares-.

10 Para la realización del procedimiento según la invención se emplearán los productos de partida, en general, en cantidades equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se llevará a cabo, en general, en un diluyente adecuado, en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agitará, en general, durante varias horas a la temperatura necesaria. La elaboración se llevará a cabo según procedimientos usuales (véanse los ejemplos de obtención).

15 Se obtienen los nuevos ácidos piridincarboxílicos substituidos de la fórmula general (II), si se hacen reaccionar ésteres substituidos de los ácidos piridincarboxílicos de la fórmula general (IV)



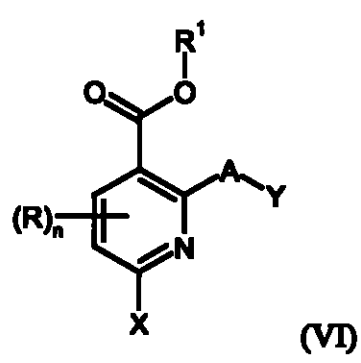
20 en la que
n, A, R y X tienen los significados anteriormente indicados,
 R^1 significa alquilo (especialmente metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo) o

significa arilalquilo (especialmente significa bencilo) y
X^I significa halógeno (especialmente cloro o bromo),
en una primera etapa con compuestos de la fórmula general (V)



5 en la que
Y tiene el significado anteriormente indicado y
M significa hidrógeno o un equivalente de metal (especialmente litio, sodio o potasio),

10 en caso dado en presencia de uno o varios auxiliares de la reacción, y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes, y se transforman los ésteres de los ácidos carboxílicos, obtenidos de este modo, de la fórmula general (VI)



en una segunda etapa, según métodos usuales, en los ácidos carboxílicos de la fórmula (II).

15 Los ésteres substituidos de los ácidos piridincarboxílicos, a ser empleados como productos de partida en el caso del procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (II), están definidos en general por medio de la fórmula (IV). En la fórmula general (IV), n, A, R, X tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente, de manera
20 especialmente preferente, de manera muy especialmente preferente o en el caso mas preferente para n, A, R, X en relación con la descripción de los compuestos según la

invención de la fórmula general (I).

Los compuestos, a ser empleados además como productos de partida en el caso del procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (II), están definidos, en general, por medio de la fórmula (V). En la fórmula general (V), Y tiene preferentemente el significado que ya ha sido indicado anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente, de manera muy especialmente preferente o en el caso mas preferente para Y en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula general (I). Los productos de partida de la fórmula general (V) son productos químicos orgánicos para síntesis, conocidos.

El procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (II) se lleva a cabo, preferentemente, en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción. Como agentes auxiliares de la reacción para el procedimiento según la invención entran en consideración, en general, las bases o aceptores de ácido inorgánicos u orgánicos usuales. A estos pertenecen, preferentemente, acetatos, amidas, carbonatos, bicarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcanolatos de metales alcalinos o de metales alcalino-térreos tales como, por ejemplo, acetato de sodio, de potasio o de calcio, amida de litio, de sodio, de potasio o de calcio, carbonato de sodio, de potasio o de calcio, bicarbonato de sodio, de potasio o de calcio, hidruro de litio, de sodio, de potasio o de calcio, hidróxido de litio, de sodio, de potasio o de calcio, metanolato, etanolato, n- o i-propanolato, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o de potasio, además, también compuestos orgánicos básicos nitrogenados tales como, por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, dicitclohexilamina, etil-dicitclohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-

piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabicyclo[2,2,0]-octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo, [4,3,0]-non-5-eno (DBN), y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-eno (DBU). Sin preferentes el hidruro de sodio, el carbonato de sodio y la trietilamina.

El procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (II) se llevará a cabo, preferentemente, con empleo de uno o varios diluyentes. Como diluyentes para la realización del procedimiento según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, especialmente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano (THF), o etilenglicoldimetil- o -dietiléter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo o butironitrilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos tal como dimetilsulfóxido. Son preferentes acetonitrilo, THF y DMF. Como diluyentes entran en consideración, para la segunda etapa, ante todo los disolventes orgánicos inertes y sus mezclas con agua. A estos pertenecen, especialmente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano (THF), o etilenglicoldimetil- o -dietiléter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo o butironitrilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como

acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos tal como dimetilsulfóxido. Es preferente el THF y mezclas de THF y agua.

Las temperaturas de la reacción, en la realización del procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (II), pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C, y preferentemente a temperaturas comprendidas entre 10°C y 120°C, de forma especialmente preferente entre 20°C y el punto de ebullición del diluyente empleado.

El procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (II) se lleva a cabo, en general, a presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo el procedimiento según la invención a presión mas elevada o bajo presión mas reducida - en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares-.

Para la realización del procedimiento según la invención se emplearán los productos de partida, en general, en cantidades equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se llevará a cabo, en general, en un diluyente adecuado, en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agitará, en general, durante varias horas a la temperatura necesaria.

La elaboración se leva a cabo según los métodos usuales, por ejemplo mediante filtración, recristalización o cromatografía (véanse los ejemplos de obtención).

Los compuestos de la fórmula (VI) pueden transformarse bien directamente ("in situ") para dar los compuestos de la fórmula (II) o aislarse como paso previo a su conversión ulterior.

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

110

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:

- 5 **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, 10 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,

- 15 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, Lolium,

- 20 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, 25 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 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 lúpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas en forma selectiva en los cultivos mono-anales.

10 Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad cuando se emplean 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 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 determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación para la lucha contra las plagas animales y contra las enfermedades de las plantas fúngicas o bacterianas. También pueden emplearse, en caso dado, a modo de productos intermedios o de 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 descadas y no descadas (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 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, 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 productos activos se lleva a cabo directamente o por acción sobre la localidad, sobre el medio ambiente o en el recinto de almacenamiento 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, ampliamente por medio de recubrimientos con una o varias capas.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de 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 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 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 éteres, las cetonas, tales como acetona,
5 metiletilcetona, metilisobutilcetona, 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 caolínes, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molturados, tales
10 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
15 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,
20 lixivitaciones sulfiticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetil-celulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de látex, 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
25 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 puede presentarse como tales o en sus formulaciones también en mezclas 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 listas para su aplicación o mezclas de tanque. También son posibles, por lo tanto, mezclas con agentes para la lucha contra las malas hierbas, que contengan uno o varios herbicidas conocidos y un protector.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo:

Acetochlor, Acifluorfen (-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxymid (-sodio), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Bflubutamid, Benazolin (-etilo), Benfuresate, Bensulfuron (-metilo), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop (-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodio), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil (-alilo), Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone (-etilo), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron (-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cinidon (-etilo), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop (-propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron (-metilo), Cloransulam (-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop (-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Dichlorprop (-P), Diclofop (-metilo), Diclosulam, Diethatyl (-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam,

- Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron (-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop (-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop (-isopropilo, -isopropilo-L, -metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop (-P-butilo),
- 5 Fluazolate, Flucarbazon (-sodio), Flufenacet, Flufenpyr, Flumetsulam, Flumiclorac (-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flurpysulfuron (-metilo, -sodio), Flurenol (-butilo), Fluridone, Fluroxypyr (-butoxipropilo, -neptilo), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet (-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate
- 10 (-ammonium), Glyphosate (-isopropilammonio), Halosafen, Haloxyfop (-etoxietilo, -P-metilo), Hexazinone, Imazamethabenz (-metilo), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron (-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlotole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Ketospiradox, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, Mecoprop, Mefenacet,
- 15 Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-) Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron (-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin,
- 20 Penoxysulam, Pentoxazone, Pethoxamid, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron (-metilo), Profluazol, Profoxydim, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propoxycarbazon (-sodio), Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-etilo), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid,
- 25 Pyriminobac (-metilo), Pyriothiobac (-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop (-P-etilo, -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, Tridiphane, 5 Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron (-metilo), Tritosulfuron.

Para las mezclas entran en consideración, además, protectores conocidos, por ejemplo

AD-67, BAS-145138, Benoxacor, Cloquintocet (-metilo), Cyometrinil, 2,4-D, DKA-24, Dichlormid, Dymron, Fenclorim, Fenchlorazol (-etilo), Flurazole, Fluxofenim, 10 Furilazole, Isoxadifen (-etilo), MCPA, Mecoprop (-P), Mefenpyr (-dietilo), MG-191, Oxabetrinil, PPG-1292, R-29148.

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 15 terreno.

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, 20 pulverización, aspersión, esparcido.

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 25 margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. Fundamentalmente dependen del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se sitúa entre 1

112

g y 10 kg de producto activo por hectárea de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hectárea.

Tal como ya se ha indicado anteriormente, pueden tratarse según la invención 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 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

De forma especialmente preferente se tratan plantas, según la invención, de las variedades de plantas usuales en el mercado o que se encuentran en utilización. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades ("características"), que se han cultivado tanto por medio de cultivo convencional, como por mutagénesis o por técnicas recombinantes de DNA. Estas pueden ser variedades, biotipos o genotipos.

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, preferentemente, según la invención, pertenecen todas
- 5 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
- 10 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 pestes animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos
- 15 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
- 20 propiedades ("características") se señalará 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 por medio de los genes *CryIA(a)*, *CryIA(b)*, *CryIA(c)*, *CryIIA*, *CryIIIA*, *CryIIIB2*, *Cry9c*, *Cry2Ab*, *Cry3Bb* y *CryIF* así como por sus combinaciones),
- 25 (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor resistencia de las plantas frente a los hongos, las

119

bacterias y los virus mediante resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientes.

Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas, por ejemplo

5 imidazolinonas, sulfonilureas, Glyphosate o Phosphinotricin (por ejemplo gen "PAT"). Los genes que proporcionan las respectivas propiedades ("características") deseadas pueden estar presentes también en combinaciones 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 las marcas

10 registradas YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes de los herbicidas pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja, que se comercializan bajo las marcas registradas Roundup Ready® (tolerancia contra

15 Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra Phosphinothricin, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia contra imidazolinonas) y STS (tolerancia contra sulfonilureas por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a los herbicidas (cultivadas convencionalmente con relación a la tolerancia a los herbicidas) pueden citarse también las variedades comercializadas para la denominación

20 Clearfield® (por ejemplo maíz). Evidentemente estas manifestaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o bien que se comercialicen o se desarrollen en el futuro con estas propiedades genéticas ("características").

Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa según la

25 invención con los compuestos de la fórmula general I o bien de las mezclas de los productos activos según la invención, presentándose además de la buena lucha contra las

-50-

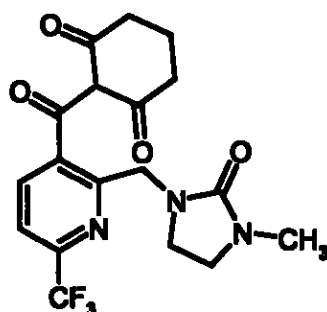
malas hierbas, los efectos sinérgicos anteriormente citados con las plantas o variedades de plantas transgénicas. Los sectores preferentes, anteriormente citados, en el caso de los productos activos o bien de las mezclas, son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Debe señalarse de manera especial el tratamiento de las plantas con los

5 compuestos o bien con las mezclas indicadas especialmente en el presente texto.

La obtención y el empleo de las sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1.



10

Se agita durante 18 horas, a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) una mezcla constituida por 1,00 g (3,63 mmoles) del ácido 6-trifluormetil-2-(3-metil-2-oxoimidazolidin-1-il-metil)-nicotínico, 0,41 g (3,63 mmoles) de ciclohexano-1,3-diona, 0,90 g (4,35 mmoles) de dicitclohexilcarbodiimida y 30 ml de acetonitrilo. A continuación se

15 añaden, a esta mezcla, 0,75 g (7,25 mmoles) de trietilamina y 0,15 g (1,45 mmoles) de cianuro de trimetilsililo y la mezcla de la reacción se agita durante 18 horas a esta temperatura. A continuación se concentra por evaporación bajo presión reducida, el residuo se agita con solución acuosa al 10 % de carbonato de sodio, se combina con dietiléter y se filtra. La fase acuosa del filtrado se separa, se acidifica con ácido

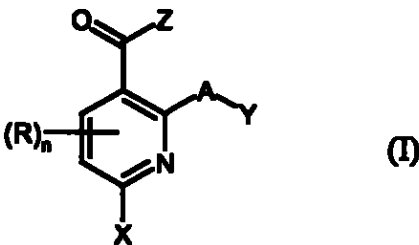
20 clorhídrico 2N y se extrae con cloruro de metileno. La solución orgánica de la extracción se lava con agua, se seca con sulfato de sodio y se filtra. El filtrado se concentra por

evaporación y el residuo se purifica mediante HPLC preparativa (cromatografía líquida de alta resolución).

Se obtienen 0,23 g (16 % de la teoría) de la 2-[2-(3-metil-2-oxo-imidazolidin-1-il-metil)-6-trifluórmetil-piridin-3-carbonil]-ciclohexano-1,3-diona.

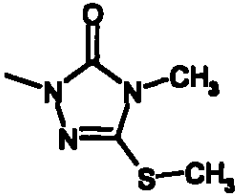
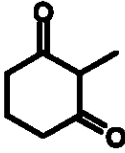
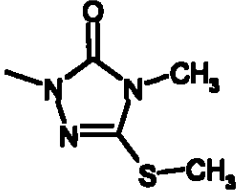
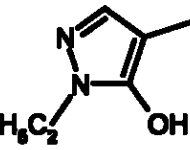
5 LogP = 2,14.

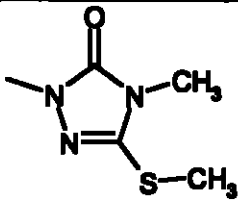
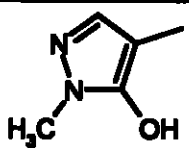
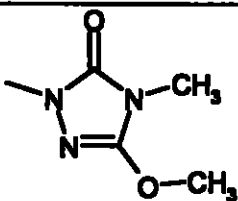
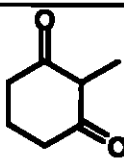
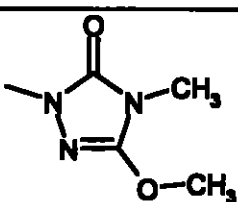
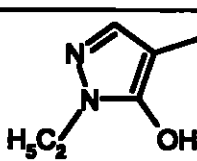
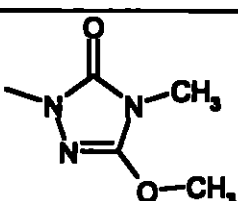
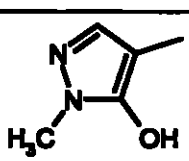
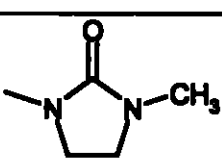
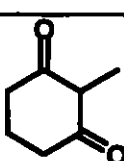
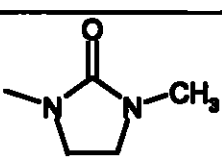
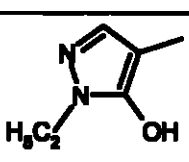
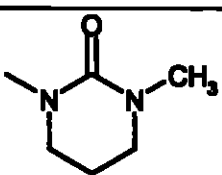
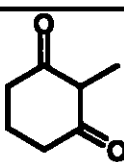
De manera análoga a la del ejemplo 1, así como de acuerdo con la descripción general del procedimiento de obtención, según la invención, pueden prepararse, por ejemplo, también los compuestos, indicados en la tabla 1 siguiente, de la fórmula general.

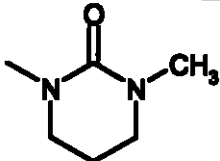
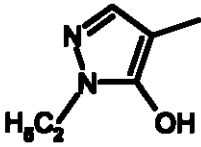
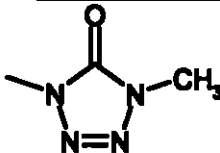
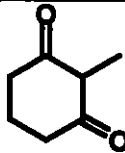
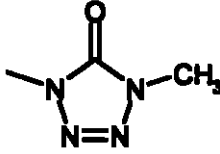
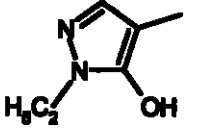
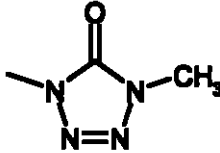
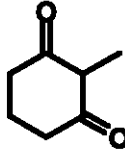
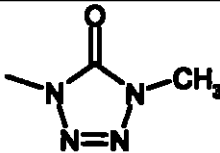
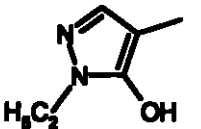
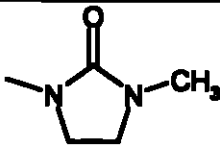
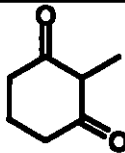
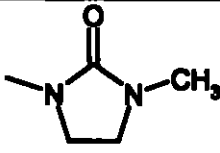
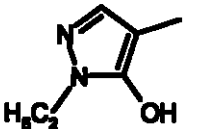
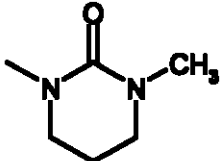
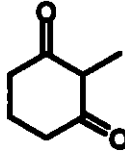


10

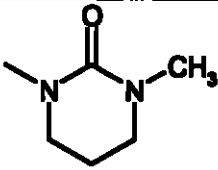
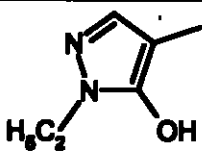
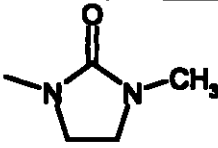
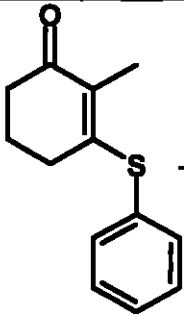
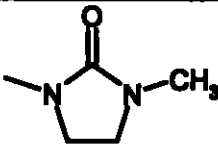
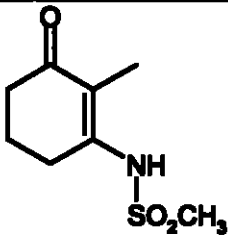
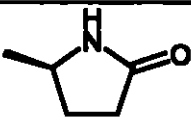
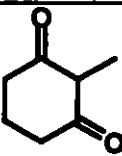
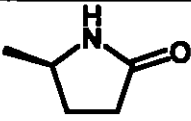
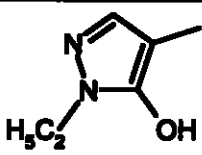
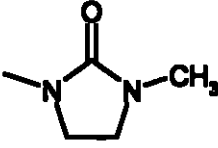
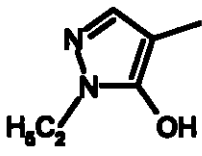
Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I)
en este caso n significa, respectivamente, el número 0

Ej. Nr.	A	X	Y	Z	Datos físicos
2	CH ₂	CF ₃			logP=2,23 ^{a)}
3	CH ₂	CF ₃			logP=1,79 ^{a)}

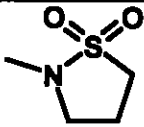
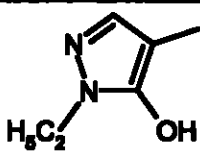
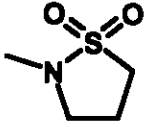
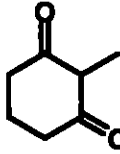
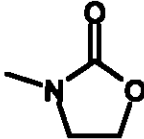
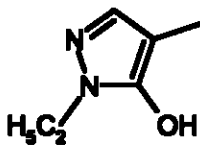
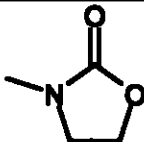
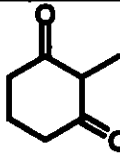
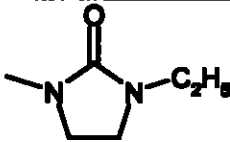
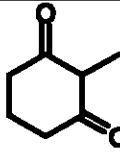
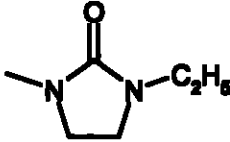
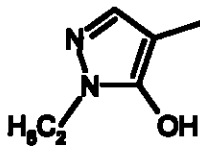
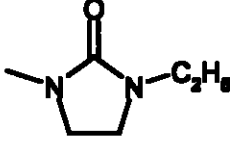
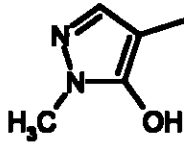
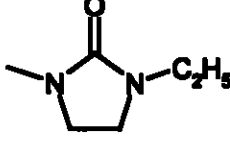
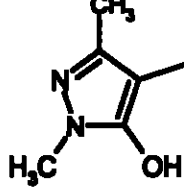
Ej. Nr.	A	X	Y	Z	Datos físicos
4	CH ₂	CF ₃			logP=1,49 ^{a)}
5	CH ₂	CF ₃			logP=2,01 ^{a)}
6	CH ₂	CF ₃			logP=1,59 ^{a)}
7	CH ₂	CF ₃			logP=1,36 ^{a)}
8	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
9	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
10	CH ₂	SO ₂ CH ₃			

Ej. Nr.	A	X	Y	Z	Datos físicos
11	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
12	CH ₂	CF ₃			
13	CH ₂	CF ₃			
14	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
15	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
16	CH ₂	OCH ₃			
17	CH ₂	OCH ₃			
18	CH ₂	Cl			

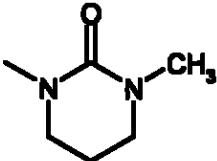
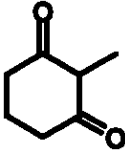
124

Ej. Nr.	A	X	Y	Z	Datos físicos
19	CH ₂	Cl			
20	CH ₂	CF ₃			
21	CH ₂	CF ₃			
22	OCH ₂	CF ₃			logP=2,09 ^{a)}
23	OCH ₂	CF ₃			logP=1,66 ^{a)}
24	CH ₂	CF ₃			logP=1,54 ^{a)}

125

Ej. Nr.	A	X	Y	Z	Datos físicos
25	CH ₂	CF ₃			logP=1,64 ^{a)}
26	CH ₂	CF ₃			logP=2,19 ^{a)}
27	CH ₂	CF ₃			logP=1,49 ^{a)}
28	CH ₂	CF ₃			logP=1,97 ^{a)}
29	CH ₂	CF ₃			logP=2,31 ^{a)}
30	CH ₂	CF ₃			logP=1,75 ^{a)}
31	CH ₂	CF ₃			logP=1,51 ^{a)}
32	CH ₂	CF ₃			logP=1,41 ^{a)}



Ej. Nr.	A	X	Y	Z	Datos físicos
33	CH ₂	CF ₃			logP=2,19 ^{a)}

La determinación de los valores logP, indicados en las tablas 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna con inversión de fases (C 18).

5 Temperatura: 43°C.



(a) Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido: ácido fosfórico acuoso al 0,1 %, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo - los resultados correspondientes de la medida se han marcado en la tabla 1 con ^{a)}.

(b) Eluyentes para la determinación en el intervalo neutro: solución tampón 0,01 molar de fosfato, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo - los resultados correspondientes de la medida se han marcado en la tabla 1 con ^{b)}.

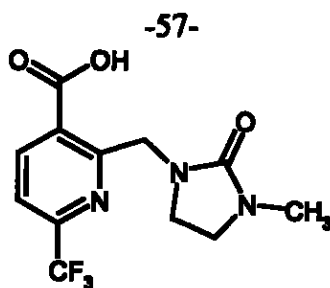
El calibrado se llevó a cabo con alcano-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores de logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).



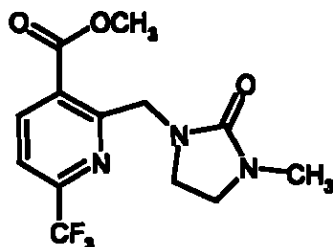
Los valores lambda-máximos se determinaron por medio de los espectros de UV con 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales de cromatografía.

Productos de partida de la fórmula (II):

20 Ejemplo II-1:



Primera etapa.

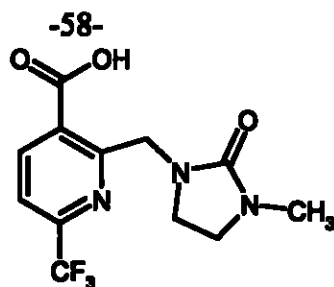


Se agita durante 60 minutos, a 80°C, una mezcla constituida por 6,2 g (62,0 mmole) de 1-metil-2-oxo-imidazolidina, 2,5 g (62,0 mmole) de hidruro de sodio y 100 ml de acetonitrilo. A continuación se añaden, a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C), 18,5 g (62,0 mmole) de 2-bromometil-6-trifluórmethyl-nicotinato de metilo y la mezcla de la reacción se agita durante 18 horas a temperatura ambiente. A continuación se añaden, con cuidado, 100 ml de agua, seguidamente se acidifica con ácido clorhídrico 2N y se sacude con cloruro de metileno. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca con sulfato de sodio y se filtra. El filtrado se concentra por evaporación bajo presión reducida y el residuo se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice (cloruro de metileno/acetonitrilo, volúmenes 9:1).

Como segunda fracción se obtienen 3,2 g (13 % de la teoría) del 6-trifluór-metil-2-(3-metil-2-oxo-imidazolidin-1-il-metil)-nicotinato de metilo.

LogP = 1,99.

Segunda etapa.



Se agita durante 18 horas, a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C), una mezcla constituida por 2,8 g (8,8 mmoles) de 6-trifluormetil-2-(3-metil-2-oxoimidazolidin-1-il-metil)-nicotinato de metilo, 0,35 g de hidróxido de sodio, 50 ml de agua y 50 ml de tetrahidrofurano. A continuación se concentra por evaporación, bajo presión reducida, aproximadamente hasta la mitad del volumen, se diluye con agua y se sacude con dietiléter. La fase acuosa se separa, se acidifica con ácido clorhídrico 2N y se extrae con acetato de etilo. La solución orgánica de extracción se lava con agua y a continuación se concentra por evaporación bajo presión reducida. El residuo se digiere con dietiléter y el producto precipitado, cristalino, se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 1,2 g (43 % de la teoría) del ácido 6-trifluormetil-2-(3-metil-2-oxoimidazolidin-1-il-metil)-nicotinoico.

LogP = 1,62.

De manera análoga pueden prepararse, por ejemplo, también los compuestos, indicados en las tablas 2 o bien 3 siguientes, de las fórmulas generales (II) o bien (VI).

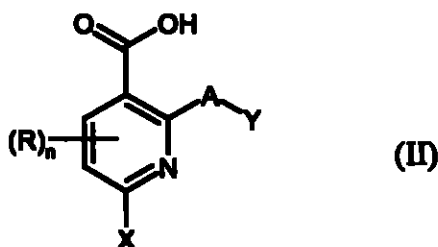
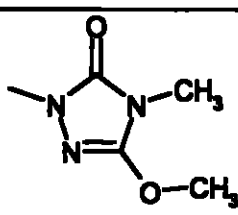
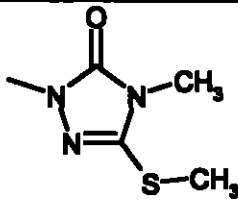
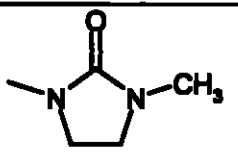
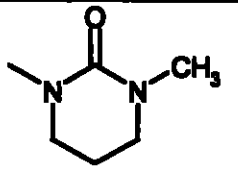
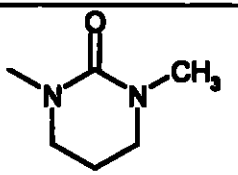
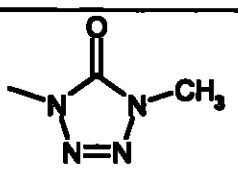
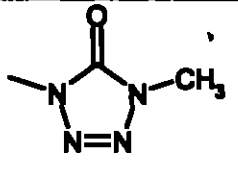
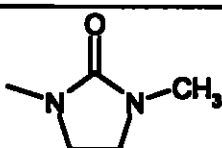
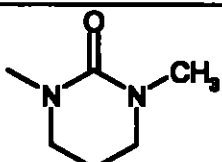
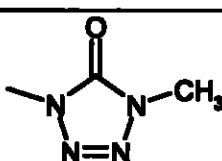
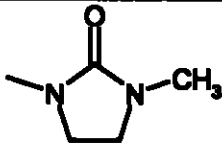
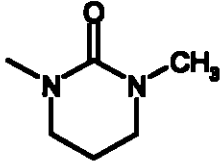
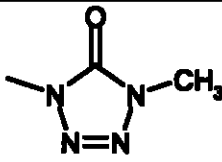
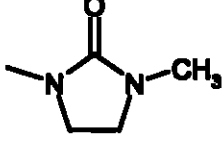
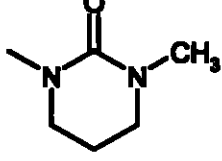


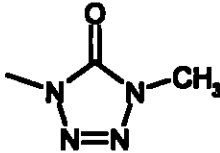
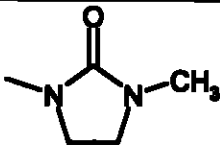
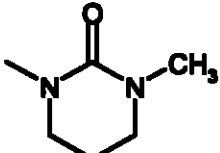
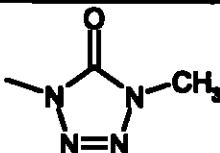
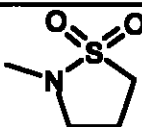
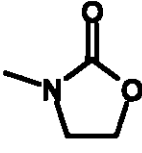
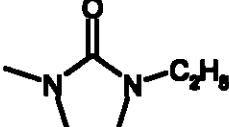
Tabla 2: Ejemplos de compuestos de la fórmula (II)
(en este caso n significa, respectivamente, el número 0

Ej.Nr.	A	X	Y	Datos fisicos
II-2	CH ₂	CF ₃		logP=1,52 ^{a)}
II-3	CH ₂	CF ₃		logP=1,72 ^{a)}
II-4	CH ₂	SO ₂ CH ₃		
II-5	CH ₂	CF ₃		logP=1,82 ^{a)}
II-6	CH ₂	SO ₂ CH ₃		
II-7	CH ₂	CF ₃		
II-8	CH ₂	SO ₂ CH ₃		

130

Ej.Nr.	A	X	Y	Datos físicos
II-9	CH ₂	OCH ₃		
II-10	CH ₂	OCH ₃		
II-11	CH ₂	OCH ₃		
II-12	CH ₂	Cl		
II-13	CH ₂	Cl		
II-14	CH ₂	Cl		
II-15	CH ₂	CN		
II-16	CH ₂	CN		

-61-

Ej.Nr.	A	X	Y	Datos físicos
II-17	CH ₂	CN		
II-18	CH ₂	CH ₃		
II-19	CH ₂	CH ₃		
II-20	CH ₂	CH ₃		
II-21	CH ₂	CF ₃		logP=1,59 ^{a)}
II-22	CH ₂	CF ₃		
II-23	CH ₂	CF ₃		logP=1,86 ^{a)}

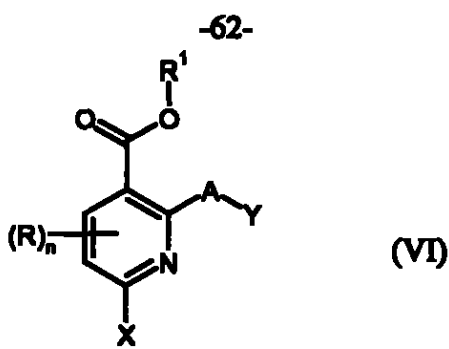
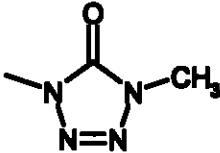
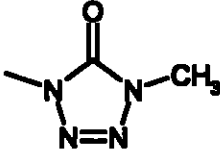
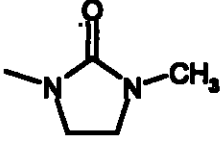
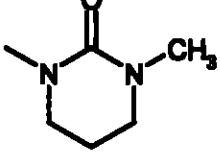
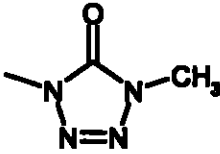
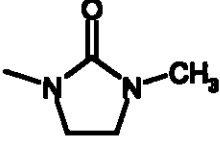
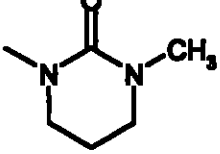
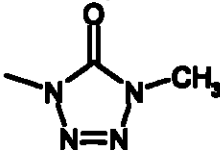
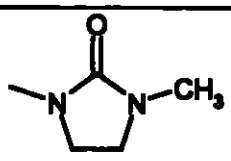
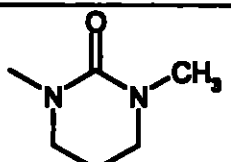
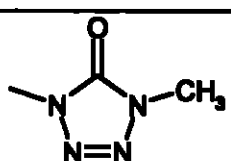
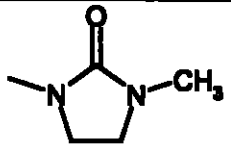
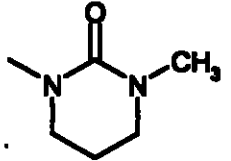
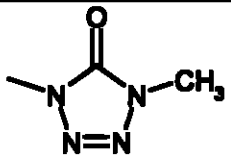
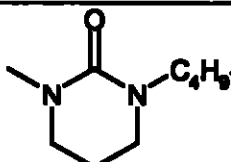
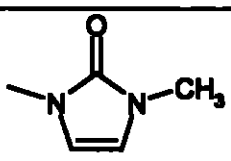


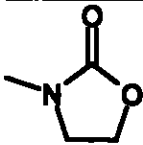
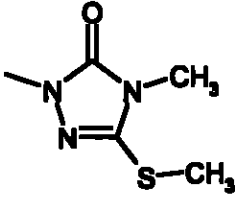
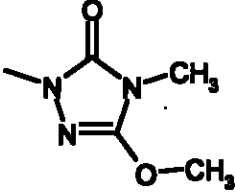
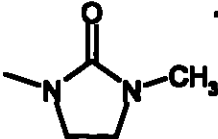
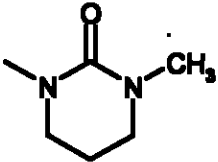
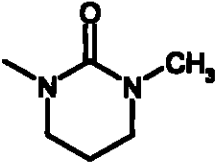
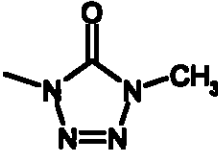
Tabla 3: Ejemplos de compuestos de la fórmula (VI)
(en este caso n significa, respectivamente el número 0)

Ej. Nr.	A	R ¹	X	Y	Datos físicos
VI-1	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,14 ^{a)}
VI-2	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=1,88 ^{a)}
VI-3	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		
VI-4	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-5	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		

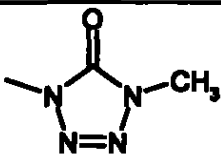
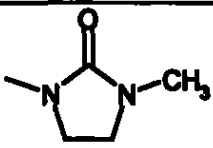
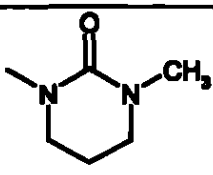
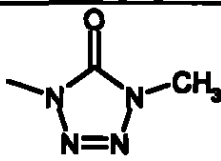
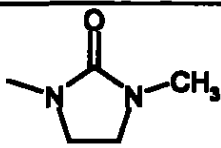
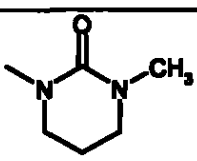
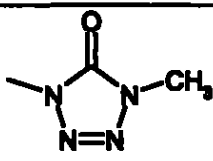
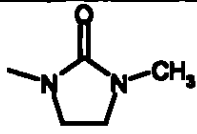
-63-

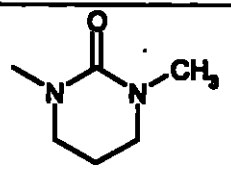
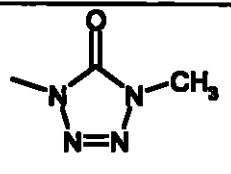
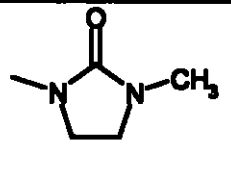
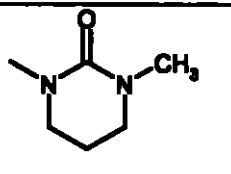
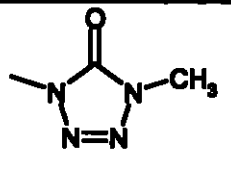
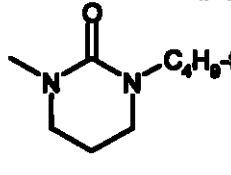
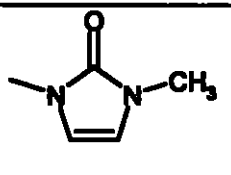
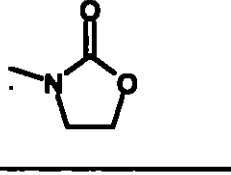
Ej. Nr.	A	R ¹	X	Y	Datos fisicos
VI-6	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-7	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		
VI-8	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-9	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-10	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-11	CH ₂	CH ₃	Cl		
VI-12	CH ₂	CH ₃	Cl		
VI-13	CH ₂	CH ₃	Cl		

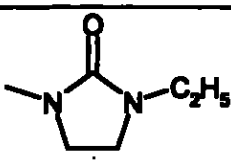
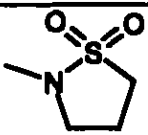
Ej. Nr.	A	R ¹	X	Y	Datos físicos
VI-14	CH ₂	CH ₃	CN		
VI-15	CH ₂	CH ₃	CN		
VI-16	CH ₂	CH ₃	CN		
VI-17	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-18	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-19	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-20	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-21	CH ₂	CH ₃	CF ₃		

Ej. Nr.	A	R ¹	X	Y	Datos físicos
VI-22	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=1,88 ^{a)}
VI-23	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-24	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-25	CH ₂	t-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-26	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-27	CH ₂	t-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-28	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		

-66-

Ej. Nr.	A	R ¹	X	Y	Datos físicos
VI-29	CH ₂	t-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-30	CH ₂	t-C ₄ H ₉	OCH ₃		
VI-31	CH ₂	t-C ₄ H ₉	OCH ₃		
VI-32	CH ₂	t-C ₄ H ₉	OCH ₃		
VI-33	CH ₂	t-C ₄ H ₉	Cl		
VI-34	CH ₂	t-C ₄ H ₉	Cl		
VI-35	CH ₂	t-C ₄ H ₉	Cl		
VI-36	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CN		

Ej. Nr.	A	R ^I	X'	Y	Datos físicos
VI-37	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CN		
VI-38	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CN		
VI-39	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CH ₃		
VI-40	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CH ₃		
VI-41	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CH ₃		
VI-42	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-43	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-44	CH ₂	t-C ₄ H ₉	CF ₃		

Ej. Nr.	A	R ¹	X	Y	Datos físicos
VI-45	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,24 ^{a)}
VI-46	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,07 ^{a)}

Ejemplos de aplicación

Ejemplo A.

Ensayo pre-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 concentración

10 desecada.

Se siembran semillas de las plantas de ensayo en terreno normal. 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 del producto activo en la preparación no juega ningún papel, siendo lo decisivo únicamente la cantidad de aplicación del producto activo por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elegirá de tal modo que se aplique en 1.000 litros de agua por hectárea la cantidad de producto activo desecada en cada caso.

15

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo del control no tratados.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles no tratados).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 3, 4, 5 y 6, con una compatibilidad parcialmente buena para con las plantas de cultivo, tales como, por ejemplo, maíz, soja y trigo, un potente efecto contra las malas hierbas.

Ejemplo B.

Ensayo de post-brote.

10 **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 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 modo que se aplique en 1.000 litros de agua/ha la cantidad deseada 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).

25 100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de

-70-

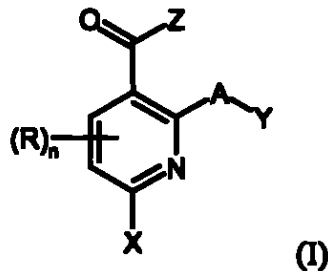
obtención 1, 2, 3, 4 y 5, con una compatibilidad ampliamente buena para con las plantas de cultivo, tales como, por ejemplo, maíz y colza, un potente efecto contra las malas hierbas.

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
5 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

n significa los números 0, 1 o 2;

A significa alcanodiilo interrumpido, en caso dado, por O (oxígeno), S (azufre), SO o SO₂ o significa α- u ω-oxaalcanodiilo, α, ω-dioxaalcanodiilo o α- u ω-tialcanodiilo o α,ω-dítialcanodiilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono;

R significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos, respectivamente, en caso dado por ciano, por hidroxí, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono;

X significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos, respectivamente, en caso dado por ciano, por hidroxí, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono;

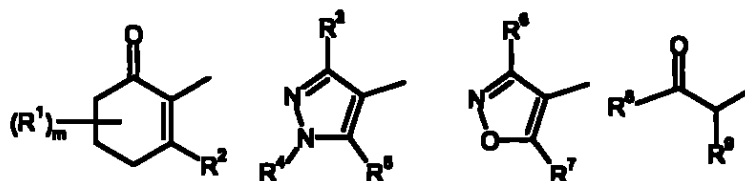
- Y significa un heterociclo con 4 hasta 12 miembros, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, que contiene como parte integrante del heterociclo desde 1 hasta 4 átomos de nitrógeno y, en caso dado, además, un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un agrupamiento SO- o un agrupamiento SO₂, 1 hasta 3 grupos oxo (C=O), 1 hasta 3 grupos tioxo (C=S) o 1 hasta 3 cianoimino (C=N-CN), enlazado a través de un átomo de nitrógeno con A, substituido en caso dado por hidroxilo, por mercapto, por ciano, por halógeno, por alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos, respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilamino o dialquilamino con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno, por alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno, por cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos, respectivamente, en caso dado, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o

-73-

por fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos, respectivamente, en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

y

5 Z significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m significa los números 0 hasta 6,

10 R¹ significa halógeno, significa alquilo o alquiltio con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxi, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenilo, o -en el caso en que m signifique 2 hasta 6- significa en caso dado también junto con un segundo

15 resto R¹, oxígeno o alcanodiilo (alquilenos) con 2 hasta 5 átomos de carbono,

20 R² significa hidroxi, formiloxi, halógeno, significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi o alquilsulfonilamino con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado por ciano, por hidroxi, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alqueniloxi o alquiniloxi con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente, en caso dado por halógeno, significa ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo,

✓✓

- arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilsulfonilamino, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, 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, 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 alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa un agrupamiento Y' -donde Y' tiene el significado indicado anteriormente para Y, sin embargo no es idéntico con Y en cada caso particular-,
- R³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcoxicarbonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos, respectivamente, en caso dado por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- R⁴ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por hidroxí, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo con,

JK5

respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente, en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, 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, 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 alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁵ significa hidroxi, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alqueniloxi o alquiniloxi con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente, en caso dado por ciano o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi con, respectivamente, 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos, respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con

116

-76-

1 a 4 átomos de carbono, 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 alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono;

5

R⁶ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

10

R⁷ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

15

R⁸ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, y

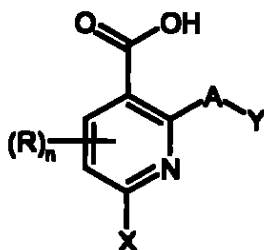
20

R⁹ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,



-con inclusión de todas las posibles formas tautómeras de los compuestos de la fórmula general (I) y de las posibles sales o bien aductos con ácidos o con bases de los compuestos de la fórmula general (I)-.

2.- Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizado porque se hacen reaccionar ácidos piridincarboxílicos, sustituidos, de la fórmula general (II)



(II)

en la que

n, A, R, X e Y tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

-o derivados reactivos de los mismos, tales como por ejemplo los halogenuros de acilo, las cianidas de acilo o los ésteres correspondientes- con compuestos de la fórmula general (III)



en la que

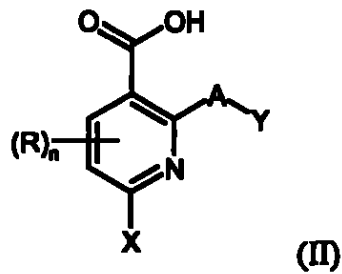
Z tiene el significado indicado en la reivindicación 1,

en caso dado en presencia de un agente deshidratante así como, en caso dado, en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

y, en caso dado, después de la realización del procedimiento según la invención se llevan a cabo, según métodos usuales, en los compuestos obtenidos de este modo, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los sustituyentes, reacciones subsiguientes (por ejemplo reacciones de sustitución, de oxidación o de reducción) para su transformación en otros compuestos de la fórmula general (I).

-78-

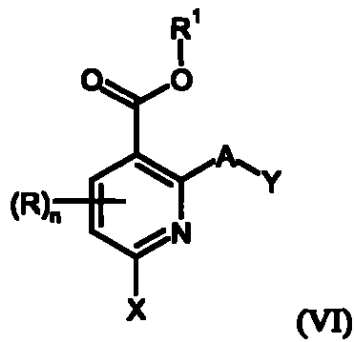
3.- Compuestos de la fórmula (II)



en la que

n, A, R, X e Y tienen el significado indicado en la reivindicación 1.

5 4.- Compuestos de la fórmula (VI)

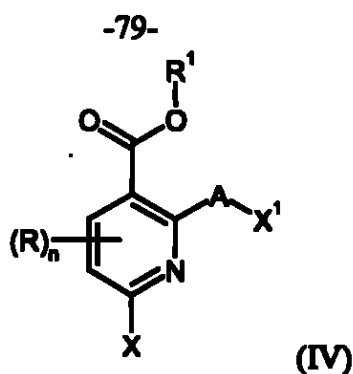


en la que

n, A, R, X e Y tienen el significado indicado en la reivindicación 1 y

R¹ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o bencilo.

10 5.- Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula (II), según la reivindicación 3, caracterizado porque se hacen reaccionar ésteres sustituidos de los ácidos piridincarboxílicos de la fórmula general (IV)



en la que

n, A, R y X tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

R¹ significa alquilo (especialmente metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo) o

5 significa arilalquilo (especialmente significa bencilo) y

X¹ significa halógeno (especialmente cloro o bromo),

en una primera etapa con compuestos de la fórmula general (V)



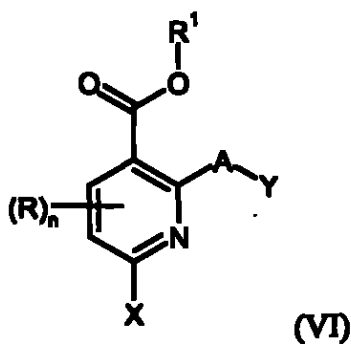
en la que

10 Y tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

M significa hidrógeno o un equivalente de metal (especialmente litio, sodio o potasio),

en caso dado en presencia de uno o varios auxiliares de la reacción, y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes, y se transforman los ésteres de los ácidos

15 carboxílicos, obtenidos de este modo, de la fórmula general (VI)



en una segunda etapa, según métodos usuales, en los ácidos carboxílicos de la fórmula (II).

6.- Agentes pesticidas, caracterizados porque tienen un contenido en al menos un compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1.

5 7.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, para la lucha contra las plagas.

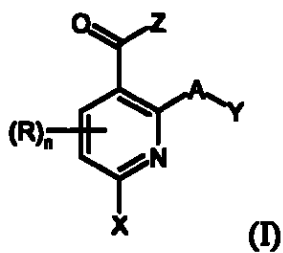
8.- Procedimiento para la lucha contra las plagas, caracterizado porque se dejan actuar compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, sobre las plagas y/o sobre su medio ambiente.

10 9.- Procedimiento para la obtención de agentes pesticidas, caracterizado porque se mezclan compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1; con extendedores y/o con agentes tensioactivos.

10.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, para la obtención de agentes pesticidas.

RESUMEN

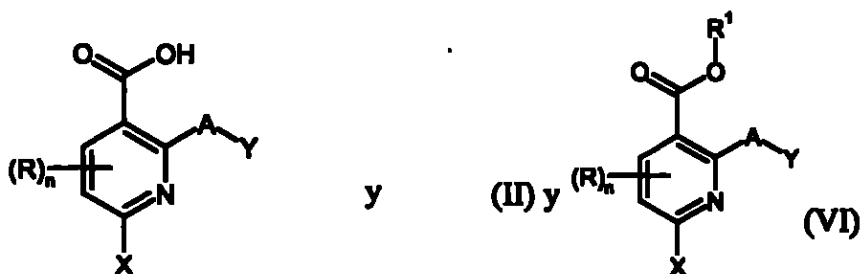
Nuevas piridilcetonas substituidas de la fórmula



en la que

- 5 A, R, X, Y, Z y n tienen los significados indicados en la descripción, procedimientos para la obtención de estos nuevos productos y su empleo como agentes para el tratamiento de las plantas, especialmente a modo de herbicidas.

Nuevos productos intermedios de las fórmulas



- 10 así como a procedimientos para su obtención.

FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Roynt
Technologies S.A.
Sede: Calle 100 No. 100-100

152

Expediente No		No de Folio
04118274		
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	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO	
10	OTROS:	

Observaciones:

Contiene 7 figuras

153

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 04110274 00000000 Folios: 153
Fecha (MM): 2004-11-24 16:56:26
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NNCI 411 PRESENTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 890176989-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 67,144
FECHA : NOVIEMBRE 8 DE 2004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	32758694	08/11/2004	55,446,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	30005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	422,000.00
		TOTAL :	\$ 422,000.00

SON: CUATROCIENTOS VEINTIDOS MIL PESOS

RESPONSABLE : 804

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cdo 13549-841-022-8

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION	()	()
Indicacion de que se solicita la concesion de una patente	()	()
Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	()	()
Descripción de la invención	()	()
Dibujos de ser estos pertinentes	()	()
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 grafica o fotografica 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 grafica del esquema de trazado	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()

Firma Responsable



Fecha Radicación: 04118274 00000000 Folios: 153
 Fecha (NPD): 2004-11-24 16:56:26
 Trámite: 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAR
 Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá DC

Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderada
BAYER CROPS SCIENCE AG.

REFERENCIA:	Radicación No.	04-118274
	Solicitud Internacional	PCT/EP2003/03948
	Fecha inicio fase nacional	29/12/2004
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	1810
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC 07 DIC. 2004


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

202057