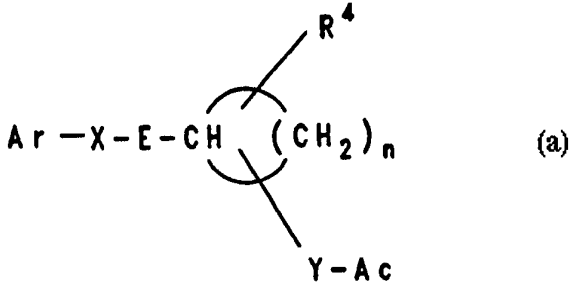


  
**PCT** WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
 Internationales Büro  
 INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
 INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

<p>(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> : <b>C07D 239/42, 239/52, A01N 43/54</b></p>	<b>A1</b>	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 95/31441</b></p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 23. November 1995 (23.11.95)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP95/01666</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 3. Mai 1995 (03.05.95)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: P 44 17 163.3 17. Mai 1994 (17.05.94) DE</p> <p>(71) Anmelder: HOECHST SCHERING AGREVO GMBH [DE/DE]; Mirastrasse 54, D-13509 Berlin (DE).</p> <p>(72) Erfinder: SCHAPER, Wolfgang; Kapellenweg 5c, D-86420 Diedorf (DE). PREUSS, Rainer; Klauslager Weg 33, D-13467 Berlin (DE). BRAUN, Peter; Rektor-Roth-Strasse 2A, D-55268 Nieder-Olm (DE). KNAUF, Werner; Im Kirschgarten 24, D-65817 Eppstein (DE). SACHSE, Burkhard; An der Ziegelei 30, D-65779 Kelkheim (DE). WALTERSDORFER, Anna; Rauenthaler Weg 28, D-60529 Frankfurt (DE). KERN, Manfred; Traminerweg 8, D-55296 Lörzweiler (DE). LÜMMEN, Peter; Rautenweg 1, D-65527 Niedernhausen (DE). BONIN, Werner; Im Schulzehnten 18, D-65779 Kelkheim (DE).</p>	<p>(81) Bestimmungsstaaten: AM, AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, FI, GE, HU, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TM, TT, UA, UZ, VN, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO Patent (KE, MW, SD, SZ, UG).</p> <p><b>Veröffentlicht</b> <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i></p>	
<p>(54) Title: HETEROCYCLYLAMINO- AND HETEROCYCLYLOXY-CYCLOALKYL DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND THEIR USE AS PESTICIDES AND FUNGICIDES</p> <p>(54) Bezeichnung: HETEROCYCLYLAMINO- UND HETEROCYCLYLOXY-CYCLOALKYL-DERIVATE, IHRE HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL UND FUNGIZIDE</p> <p>(57) Abstract</p> <p>Heterocyclylamino- and heterocycliloxy-cycloalkyl derivatives and their salts are disclosed, as well as their preparation and their use as pesticides and fungicides. In the formula (a), Ar stands for possibly substituted 4-pyridyl or 4-pyrimidinyl; X stands for NH, O or S; E is a bond or alkandiyl; n = 2-7; R<sup>4</sup> stands for H or alkyl, Y stands for O or a bond; and Ac stands for acyl. Also disclosed is a process for preparing the same, agents containing the same and their use as pesticides and fungicides.</p>		
<p>(57) Zusammenfassung</p> <p>Heterocyclylamino- und Heterocycliloxy-cycloalkyl-Derivate, ihre Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel und Fungizide der Formel (a), worin Ar gegebenenfalls substituiertes 4-Pyridyl oder 4-Pyrimidinyl; X NH, O oder S; E eine Bindung oder Alkandiyl; n = 2-7; R<sup>4</sup> H oder Alkyl, Y O oder eine Bindung; und Ac Acyl bedeuten, sowie deren Salze. Die Erfindung betrifft weiterhin Verfahren zu ihrer Herstellung, diese enthaltende Mittel und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel und Fungizide.</p>		
 <p style="text-align: right;">(a)</p>		

**LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

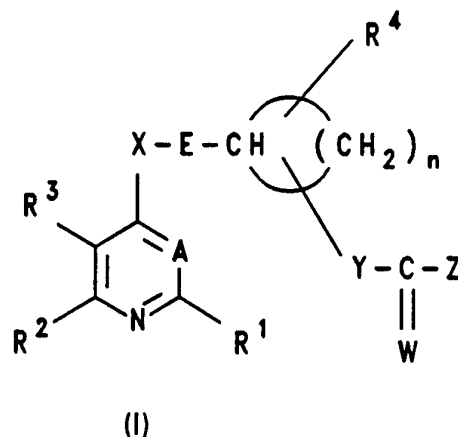
AT	Österreich	GA	Gabon	MR	Mauretanien
AU	Australien	GB	Vereinigtes Königreich	MW	Malawi
BB	Barbados	GE	Georgien	NE	Niger
BE	Belgien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BJ	Benin	IE	Irland	PL	Polen
BR	Brasilien	IT	Italien	PT	Portugal
BY	Belarus	JP	Japan	RO	Rumänien
CA	Kanada	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CG	Kongo	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CH	Schweiz	KR	Republik Korea	SI	Slowenien
CI	Côte d'Ivoire	KZ	Kasachstan	SK	Slowakei
CM	Kamerun	LI	Liechtenstein	SN	Senegal
CN	China	LK	Sri Lanka	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
ES	Spanien	MG	Madagaskar	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	ML	Mali	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MN	Mongolei	VN	Vietnam

## BESCHREIBUNG

Heterocyclylamino- und Heterocyclylloxy-cycloalkyl-Derivate, ihre Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel und Fungizide

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte 4-Cycloalkylamino- und 4-Cycloalkoxy-substituierte Stickstoff-Heterocyclen insektizide, akarizide, ixodizide und fungizide Wirkung besitzen (vgl. WO 9300536).

Es wurden neue 4-amino- und 4-alkoxy-substituierte Stickstoffheterocyclen der allgemeinen Formel I gefunden,



worin die Reste und Gruppen wie unten definiert sind, die sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität sehr gut zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, wie Insekten, Spinnentieren, Nematoden, Helminthen und Mollusken, zur Bekämpfung von Endo- und Ektoparasiten auf dem veterinärmedizinischen Gebiet und zur Bekämpfung von Schadpilzen eignen.

Die Erfindung betrifft daher Verbindungen der Formel I, in welcher

R<sup>1</sup> Wasserstoff, Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl oder (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-Cycloalkyl bedeutet;

$R^2$  und  $R^3$  gleich oder verschieden sind und jeweils Wasserstoff,  $(C_1-C_4)$ -Alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkyl,  $(C_2-C_4)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_4)$ -Halogenalkenyl,  $(C_2-C_4)$ -Alkynyl,  $(C_2-C_4)$ -Halogenalkynyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkoxy,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy- $(C_1-C_4)$ -alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkoxy- $(C_1-C_4)$ -alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy- $(C_1-C_4)$ -halogenalkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkoxy- $(C_1-C_4)$ -halogenalkyl, Halogen, Hydroxy,  $(C_1-C_4)$ -Hydroxyalkyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkanoyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkanoyl- $(C_1-C_4)$ -alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkanoyl,  $(C_3-C_5)$ -Cycloalkyl,  $(C_3-C_5)$ -Halogenocycloalkyl, Cyano,  $(C_1-C_4)$ -Cyanalkyl, Nitro,  $(C_1-C_4)$ -Nitroalkyl, Thiocyano,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy-carbonyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy-carbonyl- $(C_1-C_4)$ -alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkoxy-carbonyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkylthio,  $(C_1-C_4)$ -Alkylthio- $(C_1-C_4)$ -alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkylthio,  $(C_1-C_4)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkylsulfinyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkylsulfonyl oder  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkylsulfonyl bedeutet;

$R^2$  und  $R^3$  zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen ungesättigten 5- oder 6-gliedrigen isocyclischen Ring bilden, der, falls es sich um einen 5-Ring handelt, an Stelle von  $CH_2$  ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann oder der, falls es sich um einen 6-Ring handelt, an Stelle von einer oder zwei CH-Einheiten ein oder zwei Stickstoffatome enthalten kann und der gegebenenfalls durch 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Reste substituiert ist und diese Reste  $(C_1-C_4)$ -Alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, Halogen,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy oder  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkoxy bedeuten; oder

$R^2$  und  $R^3$  zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gesättigten 5-, 6- oder 7-gliedrigen isocyclischen Ring bilden, der an Stelle von einer oder zwei  $CH_2$ -Gruppen Sauerstoff und/oder Schwefel enthalten kann und der gegebenenfalls durch 1, 2 oder 3  $(C_1-C_4)$ -Alkylgruppen substituiert ist;

A CH oder N bedeutet;

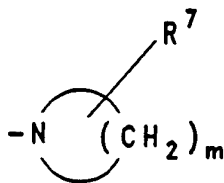
X NH, Sauerstoff oder Schwefel bedeutet;

E für eine direkte Bindung oder eine geradkettige oder verzweigte  $(C_1-C_4)$ -Alkandylgruppe, vorzugsweise für eine direkte Bindung steht;

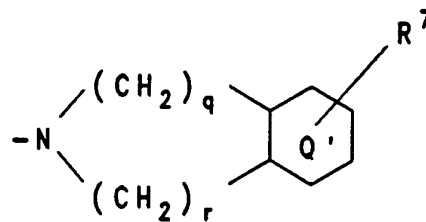
n eine ganze Zahl von 2 bis 7 ist;

- R<sup>4</sup> Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl bedeutet;
- Y Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;
- W Sauerstoff oder Schwefel, vorzugsweise Sauerstoff bedeutet;
- Z einen Rest DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet;
- D Sauerstoff, Schwefel oder eine direkte Bindung, vorzugsweise Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;
- R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Aryl oder Heterocyclyl bedeuten, wobei die aufgeführten Aryl- oder Heterocyclyl-Reste unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen der verschiedenen Resten versehen sein können und in den genannten Alkyl, Alkenyl- oder Alkynyl-Resten eine oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei nicht benachbarte gesättigte Kohlenstoff-Einheiten durch eine Carbonyl-Gruppe oder durch Heteroatom-Einheiten, wie Sauerstoff, S(O)<sub>x</sub>, mit x = 0, 1 oder 2, NR<sup>9</sup> oder SiR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> ersetzt sein können, wobei R<sup>9</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkanoyl bedeutet und R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, bevorzugt Methyl, bedeuten;
- und worin darüber hinaus 3 bis 12 Atome dieser gegebenenfalls wie vorstehend modifizierten Kohlenwasserstoff-Reste einen Cyclus bilden können und diese Kohlenwasserstoff-Reste mit oder ohne die angegebenen Variationen, gegebenenfalls mit einem oder mehreren, vorzugsweise bis zu drei, im Falle von Fluor bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Resten aus der Reihe Halogen, Aryl, Aryloxy, Arylthio, Cycloalkoxy, Cycloalkylthio, Heterocyclyl, Heterocycliloxy, Heterocyclylthio, Alkanoyl, Cycloalkanoyl, Halogenalkanoyl, Aroyl, Arylalkanoyl, Cycloalkylalkanoyl, Heterocyclylalkanoyl, Alkoxycarbonyl, Halogenalkoxycarbonyl, Cycloalkoxycarbonyl, Cycloalkylalkoxycarbonyl, Arylalkoxycarbonyl, Heterocyclylalkoxycarbonyl, Aryloxycarbonyl, Heterocycliloxycarbonyl, Alkanoyloxy, Halogenalkanoyloxy, Cycloalkanoyloxy, Cycloalkylalkanoyloxy, Aroyloxy, Arylalkanoyloxy, Heterocyclylalkanoyloxy, Alkylsulfonyloxy, Arylsulfonyloxy, Hydroxy, Cyano, Thiocyano oder Nitro substituiert sein können, wobei die

cycloaliphatischen, aromatischen oder heterocyclischen Ringsysteme unter den soeben genannten Substituenten unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Substituenten versehen sein können, mit der Maßgabe, daß wenn der Heterocyclus in Formel I das Pyridin-System bedeutet ( $A = CH$ ,  $R^2$  und  $R^3$  nicht cyclisch verknüpft) und Z den Rest  $DR^5$  bedeutet,  $R^5$  nicht  $(C_1-C_4)$ -Alkyl bedeutet,  $R^5$  und  $R^6$  ein Ringsystem der Formel II oder III bilden



II



III

worin

der Sechsring  $Q'$  gesättigt oder aromatisch ist;

$m$  eine ganze Zahl von 2 bis 7 ist;

$q$  und  $r$  Null oder ganze Zahlen sind, deren Summe eine Zahl von 2 bis 4 ergibt und worin gegebenenfalls eine  $CH_2$ -Einheit durch

Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppierung  $NR^{10}$  ersetzt ist und

$R^7$  und  $R^{10}$  gleich oder verschieden sind und jeweils Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio, Phenylalkyl oder Phenyl bedeuten und die Phenylgruppen unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Substituenten versehen sein können

und deren Salze, vorzugsweise Säureadditionssalze,

insbesondere solche Verbindungen, für die

$R^5$  und  $R^6$  Wasserstoff,  $(C_1-C_{20})$ -Alkyl,  $(C_2-C_{20})$ -Alkenyl,  $(C_2-C_{20})$ -Alkynyl, Aryl, Heterocyclyl, sowie für den Fall, daß U eine direkte Bindung darstellt, darüber hinaus Hydroxy, Cyano, Thiocyano, Nitro oder Halogen bedeutet,

wobei die aufgeführten Aryl- oder Heterocyclyl-Reste unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Resten versehen sein können und in den genannten Alkyl, Alkenyl- oder Alkynyl-Resten eine oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei nicht benachbarte gesättigte Kohlenstoff-Einheiten durch eine Carbonyl-Gruppe oder durch Heteroatom-Einheiten, wie Sauerstoff,  $S(O)_x$ , mit  $x$  0, 1 oder 2,  $NR^9$  oder  $SiR^7R^8$  ersetzt sein können, wobei  $R^9$  Wasserstoff,  $(C_1-C_4)$ -Alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy oder  $(C_1-C_4)$ -Alkanoyl bedeutet und  $R^7$  und  $R^8$   $(C_1-C_4)$ -Alkyl, bevorzugt Methyl, bedeutet, und worin darüber hinaus 3 bis 12 Atome dieser gegebenenfalls wie vorstehend modifizierten Kohlenwasserstoff-Reste einen Cyclus bilden können und diese Kohlenwasserstoff-Reste mit oder ohne die angegebenen Variationen, gegebenenfalls mit einem oder mehreren, vorzugsweise bis zu drei, im Falle von Halogen bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Resten aus der Reihe Halogen, Aryl, Aryloxy, Arylthio,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylthio, Heterocyclyl, Heterocycliloxy, Heterocyclylthio,  $(C_1-C_{20})$ -Alkanoyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkanoyl,  $(C_1-C_{20})$ -Halogenalkanoyl, Aroyl, Aryl- $(C_1-C_4)$ -alkanoyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -alkanoyl, Heterocyclyl- $(C_1-C_4)$ -alkanoyl,  $(C_1-C_{20})$ -Alkoxy-carbonyl,  $(C_1-C_{20})$ -Halogenalkoxy-carbonyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy-carbonyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -alkoxy-carbonyl, Aryl- $(C_1-C_4)$ -alkoxy-carbonyl, Heterocyclyl- $(C_1-C_4)$ -alkoxy-carbonyl, Aryloxy-carbonyl, Heterocycliloxy-carbonyl,  $(C_1-C_{20})$ -Alkanoyloxy,  $(C_2-C_{20})$ -Halogenalkanoylalkoxy,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkanoyloxy,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -alkanoyloxy, Aroyloxy, Aryl- $(C_1-C_4)$ -alkanoyloxy, Heterocyclyl- $(C_1-C_4)$ -alkanoyloxy,  $(C_1-C_{20})$ -Alkylsulfonyloxy, Arylsulfonyloxy, Hydroxy, Cyano, Thiocyano oder Nitro substituiert sein können, wobei die cycloaliphatischen, aromatischen oder heterocyclischen Ringsysteme unter den soeben genannten Substituenten unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Substituenten versehen sein können,

$R^5$  und  $R^6$  ein Ringsystem der Formel II oder III bilden

worin

der Sechsring Q' gesättigt oder aromatisch ist;

m eine ganze Zahl von 2 bis 7 ist;

q und r ganze Zahlen sind, deren Summe eine Zahl von 2 bis 4 ergibt und

worin gegebenenfalls eine  $CH_2$ -Einheit durch Sauerstoff,

Schwefel oder eine Gruppierung  $NR^{10}$  ersetzt sein kann und

$R^7$  und  $R^8$  gleich oder verschieden sind und jeweils Wasserstoff,  $(C_1-C_8)$ -

Alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy,  $(C_1-C_4)$ -

Alkylthio, Phenyl- $(C_1-C_4)$ -alkyl oder Phenyl bedeuten und die

Phenylgruppen unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von

Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen

Substituenten versehen sein können,

und diese Substituenten vorzugsweise aus der Gruppe  $(C_1-C_4)$ -

Alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy,  $(C_1-C_4)$ -

Halogenalkoxy,  $(C_1-C_4)$ -Alkylthio und Halogen ausgewählt werden;

und des weiteren für den Fall, daß n die Zahl 5 bedeutet und E eine direkte Bindung bedeutet die Gruppen -X-E und Y-C-Z



vorzugsweise zueinander cis-ständig sind und die Positionen 1 und 4 am Cyclohexanring einnehmen.

Bevorzugt sind weiter solche Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin

$R^1$  Wasserstoff bedeutet;

$R^2$   $(C_1-C_4)$ -Alkyl, Cyclopropyl,  $(C_1-C_4)$ -Halogenalkyl oder Methoxymethyl bedeutet;

$R^3$  Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Halogen oder Cyano bedeutet; oder

$R^2$  und  $R^3$  zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind einen ungesättigten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der im Falle des 5-

- Rings an Stelle einer CH<sub>2</sub>-Einheit ein Schwefelatom enthalten kann oder R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gesättigten 5-oder 6-gliedrigen Ring bilden, der an Stelle einer CH<sub>2</sub>-Einheit ein Schwefel- oder ein Sauerstoffatom enthalten kann;
- A CH oder N bedeutet;
- X NH oder Sauerstoff bedeutet;
- E für eine direkte Bindung steht;
- R<sup>4</sup> Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl bedeutet;
- Y Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;
- W Sauerstoff bedeutet;
- Z einen Rest DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet; und
- D Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;
- insbesondere solche Verbindungen für die
- R<sup>2</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkyl, Cyclopropyl, Trifluormethyl oder Methoxymethyl bedeutet;
- R<sup>3</sup> Methyl, Ethyl, Methoxy, Halogen oder Cyano bedeutet; oder
- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, das Chinazolin- oder Chinolin-System bilden; oder
- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen an die sie gebunden sind, einen gesättigten 6-gliedrigen Ring bilden, der ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und
- Z einen Rest DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet;
- besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel I, worin
- R<sup>1</sup> Wasserstoff bedeutet;
- R<sup>2</sup> Ethyl, Propyl, Isopropyl oder Methoxymethyl bedeutet;
- R<sup>3</sup> Fluor, Chlor, Brom oder Methoxy bedeutet;
- oder
- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, das Chinazolin-System bilden, das mit Fluor, Chlor, Brom und/oder Methyl substituiert sein kann; oder
- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit dem Pyrimidin-Ring das 5,6,7,8-Tetrahydrochinazolin-System bilden
- A CH oder N bedeutet;

- X NH bedeutet;
- E für eine direkte Bindung steht;
- R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet;
- n die Zahl 4 oder 5 bedeutet;
- Y Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;
- Z DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet;
- D Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet und
- W Sauerstoff bedeutet.

Ganz besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel I, worin

- R<sup>1</sup> Wasserstoff bedeutet;
- R<sup>2</sup> Methoxymethyl und R<sup>3</sup> Methoxy oder Chlor bedeutet;
- R<sup>2</sup> Ethyl, Propyl, Isopropyl und R<sup>3</sup> Chlor oder der Brom bedeutet;  
oder
- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, das  
Chinazolin-System bilden;
- A CH oder N bedeutet;
- X NH bedeutet;
- E für eine direkte Bindung steht;
- R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet;
- n die Zahl 4 oder 5 bedeutet;
- Y eine direkte Bindung bedeutet;
- Z DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet;
- D Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet und
- W Sauerstoff bedeutet.

Am stärksten hiervon bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, worin

- R<sup>1</sup> Wasserstoff bedeutet;
- R<sup>2</sup> Methoxymethyl und R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten;  
oder
- R<sup>2</sup> Ethyl und R<sup>3</sup> Chlor oder Brom bedeutet; oder

- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen an die sie gebunden sind, das Chinazolin-System bilden;
- A Stickstoff bedeutet;
- X NH bedeutet
- E für eine direkte Bindung steht;
- R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet;
- n die Zahl 5 bedeutet und die Reste in der 1,4-Position stehen und cis-ständig zueinander sind;
- Y eine direkte Bindung bedeutet;
- W Sauerstoff bedeutet;
- Z DR<sup>5</sup> bedeutet;
- D Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;  
und unter den Gruppen DR<sup>5</sup> diejenigen hervorgehoben werden, worin
- R<sup>5</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cycloalkyl, Phenyl oder Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl bedeuten und die Phenylreste unsubstituiert oder wie oben zu R<sup>5</sup> = Aryl angegeben substituiert sein können; oder
- Z NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet und
- R<sup>5</sup> hier vorzugsweise (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl und
- R<sup>6</sup> hier vorzugsweise (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, Phenyl oder Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl bedeutet und die Phenylreste unsubstituiert oder wie oben zu R<sup>6</sup> = Aryl angegeben substituiert sein können oder R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> ein Ringsystem der Formel II oder III bilden können.

In der obigen Formel ist unter "Halogen" ein Fluor-, Chlor-, Brom- oder Iodatom vorzugsweise ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom zu verstehen;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" ein unverzweigter oder verzweigter Kohlenwasserstoffrest mit 1-4 Kohlenstoffatomen, wie z.B. der Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, 1-Butyl-, 2-Butyl-, 2-Methylpropyl- oder tert.-Butylrest; unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkyl" die vorgenannten Alkylreste, wie z.B. der Pentyl-, 2-Methylbutyl- oder der 1,1-Dimethylpropylrest, der Hexyl-, Heptyl-, Octyl-, 1,1,3,3-Tetramethylbutyl-, Nonyl-, 1-Decyl-, 2-Decyl-, Undecyl-,

Dodecyl-, Pentadecyl- oder Eicosyl-Rest;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkyl" eine unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" genannte Alkylgruppe, in der eines oder mehrere Wasserstoffatome durch die obengenannten Halogenatome, bevorzugt Chlor oder Fluor, ersetzt sind, wie beispielsweise die Trifluormethylgruppe, die 1-Fluorethylgruppe, die 2,2,2-Trifluorethylgruppe, die Chlormethyl-, Fluormethylgruppe, die Difluormethylgruppe oder die 1,1,2,2-Tetrafluorethylgruppe;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Fluoralkyl" z.B. die 1-Fluorethyl-, 2-Fluorethyl-, 1,1-Difluorethyl- oder die 2,2,2-Trifluorethyl-Gruppe zu verstehen;  
unter dem Ausdruck "Cycloalkyl" vorzugsweise (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl;  
unter dem Ausdruck "Cycloalkoxy" vorzugsweise (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxy;  
unter dem Ausdruck "Cycloalkylthio" vorzugsweise (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylthio;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-Cycloalkyl" die Cyclopropyl-, Cyclobutyl- oder Cyclopentylgruppe;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl" die oben unter (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-Cycloalkyl" genannten Reste, wie der Cyclohexyl-, Cycloheptyl- oder Cyclooctyl-Rest;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-Halogenycycloalkyl" eine der oben aufgeführten (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-Cycloalkylreste, in denen eines oder mehrere, im Falle von Fluor gegebenenfalls auch alle Wasserstoffatome durch Halogen, bevorzugt Fluor oder Chlor, ersetzt sind, wie beispielsweise die 2,2-Difluor- oder 2,2-Dichlorcyclopropan-Gruppe oder der Fluorcyclopentan-Rest;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkenyl" z.B. die Vinyl-, Allyl-, 2-Methyl-2-propenyl- oder 2-Butenyl-Gruppe;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkenyl" die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die 2-Pentenyl-, 2-Decenyl- oder die 2-Eicosenyl-Gruppe;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkenyl" eine (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkenyl-Gruppe in der die Wasserstoffatome teilweise oder im Falle von Fluor auch vollständig durch Halogen, bevorzugt Fluor oder Chlor ersetzt sind;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkynyl z.B. die Ethinyl-, Propargyl, 2-Methyl-2-propinyl oder 2-Butinyl-Gruppe;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkynyl" die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die 2-Pentinyl- oder die 2-Decinyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkinyl" eine (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkinylgruppe in der die Wasserstoffatome teilweise, im Falle von Fluor auch vollständig, durch Halogenatome, bevorzugt Fluor oder Chlor, ersetzt sind;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Hydroxyalkyl" z.B. die Hydroxymethyl-, 1-Hydroxyethyl-, 2-Hydroxyethyl-, 1-Hydroxy-1-methyl-ethyl- oder die 1-Hydroxypropyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkanoyl" z.B. die Formyl-, Acetyl-, Propionyl-, 2-Methylpropionyl- oder Butyryl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkanoyl" eine (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkanoyl-Gruppe, in der die Wasserstoffatome teilweise, im Falle von Fluor auch vollständig, durch Halogenatome, bevorzugt Fluor oder Chlor ersetzt sind;

unter dem Ausdruck "Cyan-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl" eine Cyanalkyl-Gruppe, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" angegebenen Bedeutungen hat;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-carboxy" z.B. die Methoxycarbonyl-, Ethoxycarbonyl-, Propoxycarbonyl-, Butoxycarbonyl oder tert.-Butoxycarbonyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-Alkoxy-carbonyl" die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die Hexyloxycarbonyl-, 2-Methylhexyloxycarbonyl-, Decyloxycarbonyl- oder Dodecyloxycarbonyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy-carbonyl" eine (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-carbonyl-Gruppe in der eines oder mehrere, im Falle von Fluor gegebenenfalls auch alle Wasserstoffatome, durch Halogen, bevorzugt Fluor oder Chlor, ersetzt sind;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio" eine Alkylthiogruppe, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" angegebene Bedeutung hat;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkylthio" eine (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio-Gruppe, in der eines oder mehrere, im Falle von Fluor gegebenenfalls auch alle Wasserstoffatome des Kohlenwasserstoff-Teils durch Halogen, insbesondere Chlor oder Fluor ersetzt sind;

unter dem Ausdruck "Fluormethyl" die Mono-, Di- und Trifluormethylthio-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfinyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfinyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfonyl-Gruppe;

unter den Ausdrücken "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkylsulfinyl" und "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkylsulfonyl" (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfinyl- und -sulfonyl-Reste mit den oben angegebenen Bedeutungen, bei denen eines oder mehrere, im Falle von Fluor gegebenenfalls auch alle Wasserstoffatome des Kohlenwasserstoff-Teils durch Halogen, insbesondere Chlor oder Fluor ersetzt sind;

unter den Ausdrücken "Fluormethylsulfinyl" und "Fluormethylsulfonyl" die Mono-, Di- und Trifluormethyl-sulfinyl- und -sulfonyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy" eine Alkoxygruppe, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" angegebene Bedeutung hat;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy" eine Halogenalkoxygruppe, deren Halogen-Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkyl" angegebene Bedeutung hat;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl" beispielsweise eine 1-Methoxyethylgruppe, eine 2-Methoxyethylgruppe, eine 2-Ethoxyethylgruppe, eine Methoxymethyl- oder Ethoxymethylgruppe, eine 3-Methoxypropylgruppe oder eine 4-Butoxybutylgruppe;

unter den Ausdrücken "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl", "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-halogenalkyl" und "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-halogenalkyl" (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-Reste mit den oben angegebenen Bedeutungen, bei denen eines oder mehrere, im Falle von Fluor gegebenenfalls auch alle Wasserstoffatome der entsprechenden Kohlenwasserstoff-Anteile durch Halogen, bevorzugt Chlor oder Fluor ersetzt sind;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl" beispielsweise Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Propylthiomethyl, 2-Methylthioethyl, 2-Ethylthioethyl oder 3-Methylthiopropyl;

unter dem Ausdruck "Aryl" ein isocyclischer aromatischer Rest mit vorzugsweise 6 bis 14, insbesondere 6 bis 12 C-Atomen, wie beispielsweise Phenyl, Naphthyl oder Biphenyl, vorzugsweise Phenyl;

unter dem Ausdruck "Heterocyclyl" ein heteroaromatisches oder heteroaliphatisches Ringsystem, wobei unter "heteroaromatisches Ringsystem" ein Arylrest, worin mindestens eine CH-Gruppe durch N ersetzt ist und/oder mindestens zwei benachbarte CH-Gruppen durch S, NH oder O ersetzt sind, zu verstehen ist, z.B. ein Rest von Thiophen, Furan, Pyrrol, Thiazol, Oxazol, Imidazol, Isothiazol, Isoxazol, Pyrazol, 1,3,4-Oxadiazol, 1,3,4-Thiadiazol, 1,3,4-Triazol, 1,2,4-Oxadiazol, 1,2,4-Thiadiazol, 1,2,4-Triazol, 1,2,3-Triazol, 1,2,3,4-Tetrazol, Benzo[b]thiophen, Benzo[b]furan, Indol, Benzo[c]thiophen, Benzo[c]furan, Isoindol, Benzoxazol, Benzothiazol, Benzimidazol, Benzisoxazol, Benzisothiazol, Benzopyrazol, Benzothiadiazol, Benzotriazol, Dibenzofuran, Dibenzothiophen, Carbazol, Pyridin, Pyrazin, Pyrimidin, Pyridazin, 1,3,5-Triazin, 1,2,4-Triazin, 1,2,4,5-Triazin, Chinolin, Isochinolin, Chinoxalin, Chinazolin, Cinnolin, 1,8-Naphthyridin, 1,5-Naphthyridin, 1,6-Naphthyridin, 1,7-Naphthyridin, Phthalazin, Pyridopyrimidin, Purin, Pteridin oder 4H-Chinolizin;

und unter dem Ausdruck "heteroaliphatisches Ringsystem" einen (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylrest in dem mindestens eine Kohlenstoff-Einheit durch O, S oder eine Gruppe NR<sup>11</sup> ersetzt ist und R<sup>11</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy oder Aryl bedeutet;

unter dem Ausdruck "Arylthio" z.B. die Phenylthio- oder die 1- oder 2-Naphthylthio-Gruppe;

unter dem Ausdruck "Aryloxy" z.B. die Phenoxy- oder 1- oder 2-Naphthylloxy-Gruppe;

unter dem Ausdruck "Heterocyclyloxy" oder "Heterocyclylthio" einen der oben genannten heterocyclischen Reste die über ein Sauerstoff- oder Schwefelatom verknüpft sind;

unter dem Ausdruck "(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxy-carbonyl" z.B. die Cyclobutyloxy-carbonyl-, Cyclopentyloxy-carbonyl-, Cyclohexyloxy-carbonyl- oder die Cycloheptyloxy-carbonyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxycarbonyl" z.B. die Cyclopropylmethoxycarbonyl-, Cyclobutylmethoxycarbonyl-, Cyclopentylloxymethylcarbonyl, Cyclohexylloxymethylcarbonyl-, 1-(Cyclohexyl)-ethoxycarbonyl- oder die 2-(Cyclohexyl)-ethoxycarbonyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxycarbonyl" z.B. die Benzyloxycarbonyl-, 1-Naphthylmethoxycarbonyl-, 2-Naphthylmethoxycarbonyl-, 1-Phenyl-ethoxycarbonyl- oder die 2-Phenyl-ethoxycarbonyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "Aryloxycarbonyl" z.B. die Phenoxy-carbonyl-, Naphthoxy-carbonyl- oder die Biphenyloxycarbonyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkanoyl" z.B. die Thenoyl-, Furoyl, Thienylacetyl- oder die Pyridylacetyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxycarbonyl" z.B. die Thimethoxycarbonyl-, Furylmethoxycarbonyl-, Pyridylmethoxycarbonyl- oder die Thienylethoxycarbonyl-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkanoxyloxy" z.B. die Formyloxy-, Acetoxy-, Propionyloxy-, Butyryloxy-, Pivaloyloxy-, Valeroyloxy- oder die Hexanoyloxy-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-Halogenalkanoyloxy" eine (C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkanoyloxy-Gruppe in der eines oder mehrere, im Falle von Fluor gegebenenfalls auch alle Wasserstoffatome des Kohlenwasserstoff-Teils durch Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor ersetzt sind;

unter dem Ausdruck "(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkanoyloxy" z.B. die Cyclopropanoyloxy-, Cyclobutenoyloxy-, Cyclopentanoyloxy-, Cyclohexanoyloxy- oder die Cycloheptanoyloxy-Gruppe;

unter dem Ausdruck "(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkanoyloxy" z.B. die Cyclopropylcarbonyloxy-, Cyclopropylacetoxy-, Cyclobutylcarbonyloxy-, Cyclopentylcarbonyloxy-, Cyclohexylcarbonyloxy-, Cyclohexylacetoxy- oder die 4-Cyclohexyl-butyryloxy-Gruppe;

unter dem Ausdruck "Aroyloxy" z.B. die Benzoyloxy- oder die Naphthoyloxy-Gruppe;

unter dem Ausdruck "Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkanoyloxy" z.B. die Thienylcarbonyloxy-, Thienylacetoxy-, Pyridylcarbonyloxy- oder die Pyrimidinylcarbonyloxy-Gruppe;  
unter dem Ausdruck "Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkanoyloxy" z.B. die Benzoyloxy-, Naphthoyloxy- oder die Phenylacetoxy-Gruppe;  
unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkylsulfonyloxy" z.B. die Methan-, Ethan-, Butan- oder Hexansulfonyloxy-Gruppe;  
unter dem Ausdruck "Arylsulfonyloxy" z.B. die Phenylsulfonyloxy- oder die Toluolsulfonyloxy-Gruppe.

Zu den Substituenten mit denen die verschiedenen aliphatischen, aromatischen und heterocyclischen Ringsysteme versehen sein können, zählen z.B. Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Trialkylsilyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkoxy-[CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>]<sub>1,2</sub>-ethoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Halogenphenoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylphenoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxyphenoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxyphenoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkylphenoxy, Phenylthio, Heterocyclyl, Heterocyclylthio oder Heterocyclyloxy, wobei in den Alkylresten und den davon abgeleiteten Resten eines oder mehrere Wasserstoffatome, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl durch Halogen, bevorzugt Chlor oder Fluor, ersetzt sein können.

Weiterhin ist unter der Definition, daß "in den genannten Alkyl, Alkenyl- oder Alkinyl-Resten eine oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei nicht benachbarte gesättigte Kohlenstoff-Einheiten durch eine Carbonyl-Gruppe oder durch Heteroatom-Einheiten, wie Sauerstoff, S(O)<sub>x</sub>, mit x = 0, 1 oder 2, NR<sup>9</sup> oder SiR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> ersetzt sein können, wobei R<sup>9</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkanoyl bedeutet und R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, bevorzugt Methyl, bedeuten;  
und worin darüber hinaus 3 bis 12 Atome dieser gegebenenfalls wie vorstehend modifizierten Kohlenwasserstoff-Reste einen Cyclus bilden können und diese Kohlenwasserstoff-Reste mit oder ohne die angegebenen Variationen,

gegebenenfalls mit einem oder mehreren, vorzugsweise bis zu drei, im Falle von Fluor bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Resten aus der Reihe Halogen, Aryl, Aryloxy, Arylthio, Cycloalkoxy, Cycloalkylthio, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, Alkanoyl, Cycloalkanoyl, Halogenalkanoyl, Aroyl, Arylalkanoyl, Cycloalkylalkanoyl, Heterocyclylalkanoyl, Alkoxy-carbonyl, Halogenalkoxy-carbonyl, Cycloalkoxy-carbonyl, Cycloalkylalkoxy-carbonyl, Arylalkoxy-carbonyl, Heterocyclylalkoxy-carbonyl, Aryloxy-carbonyl, Alkanoyloxy, Halogenalkanoyloxy, Cycloalkanoyloxy, Cycloalkylalkanoyloxy, Aroyloxy, Arylalkanoyloxy, Heterocyclylalkanoyloxy, Alkylsulfonyloxy, Arylsulfonyloxy, Hydroxy, Cyano, Thiocyano oder Nitro substituiert sein können, wobei die cycloaliphatischen, aromatischen oder heterocyclischen Ringsysteme unter den soeben genannten Substituenten unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Substituenten versehen sein können,

z.B. zu verstehen:

Alkoxyalkyl-Reste, wie z.B. die Methoxymethyl-, Methoxyethyl oder Ethoxyethyl-Gruppe; oder

Alkoxy-alkoxy-alkyl-Reste, wie z.B. die Methoxy- oder die Ethoxy-ethoxyethyl-Gruppe; oder

Alkylthioalkyl-Reste, wie z.B. die Methyl- oder die Ethylthioethyl-Gruppe; oder Alkylsulfinyl-alkyl-Reste, wie z.B. die Methyl- oder Ethylsulfinylethyl-Gruppe; oder

Alkylsulfonyl-alkyl-Reste, wie z.B. die Methyl- oder Ethylsulfonylethyl-Gruppe; oder

Alkyl-dialkylsilyl-alkyl-, vorzugsweise Alkyl-dimethylsilyl-alkyl-Reste, wie z.B. die Trimethylsilylmethyl- oder die Trimethylsilylethyl-Gruppe; oder

Trialkylsilyl-, vorzugsweise Alkyldimethylsilyl-Reste, wie z.B. die Trimethylsilyl-, Ethyldimethylsilyl-, tert.-Butyldimethylsilyl- oder die Octyldimethylsilyl-Gruppe; oder

Cycloalkyldialkylsilyl-, vorzugsweise Cycloalkyldimethylsilyl-Reste, wie z.B. die Cyclohexyldimethylsilyl-Gruppe; oder

Aryldialkylsilyl-, vorzugsweise Aryldimethylsilyl-Reste wie z.B. Phenyldimethylsilyl-Gruppe; oder

Arylalkyldialkylsilyl-, vorzugsweise Aryldimethylsilyl-Reste wie z.B. die Benzoyldimethylsilyl oder die Phenylethyldimethylsilyl-Gruppe; oder

Alkanoylalkyl-Reste wie z.B. die Acetylmethyl- oder die Pivaloylmethyl-Gruppe; oder

Cycloalkanoylalkyl-Reste wie z.B. die Cyclopropylcarbonylmethyl- oder die Cyclohexylcarbonylmethyl-Gruppe; oder

Halogenalkanoylalkyl-Reste wie z.B. die Trifluor- oder Trichloracetylmethyl-Gruppe; oder

Aroylalkyl-Reste wie z.B. die Benzoyl- oder Naphthoylalkyl-Reste wie z.B. die Phenylacetylmethyl-Gruppe; oder

Heterocyclcarbonylalkyl-Reste wie z.B. die Thienyl- oder Pyridylacetylmethyl-Gruppe; oder

Aryl-alkyl-Reste, wie z.B. die Benzyl-, die 2-Phenylethyl-, die 1-Phenylethyl-, die 1-Methyl-1-phenylethylgruppe, die 3-Phenylpropyl-, die 4-Phenylbutylgruppe, die 2-Methyl-2-phenyl-ethylgruppe oder die 1-Methyl- oder 2-Methylnaphthylgruppe; oder

Heterocyclalkyl-Reste, wie z.B. die Thienylmethyl-, Pyridylmethyl-, Furfuryl-, Tetrahydrofurfuryl-, Tetrahydropyranylmethyl- oder die 1,3-Dioxalanyl-2-methyl-Gruppe; oder

Aryloxyalkyl-Reste, wie z.B. die Phenoxymethyl- oder Naphthoxymethyl-Gruppe; oder

Cycloalkylreste, monocyclisch wie z.B. der Cyclopropyl-, Cyclobutyl-, Cyclopentyl-, Cyclohexyl-, Cycloheptyl- oder Cyclooctyl-Rest, bicyclisch wie z.B. der Norbornylrest oder der Bicyclo[2,2,2]octan-Rest oder kondensiert wie der Decahydronaphthyl-Rest;

Alkyl-cycloalkyl-Reste wie z.B. die 4-Methyl- oder die 4-tert.-Butylcyclohexyl-Gruppe oder die 1-Methyl-cyclopropyl-, -cyclobutyl-, -cyclopentyl- oder -cyclohexyl-Gruppe;

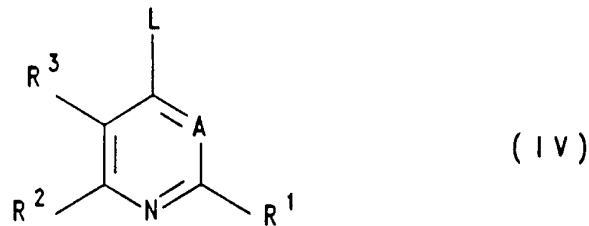
Cyclohexyl-alkyl-Reste wie z.B. die Cyclohexylmethyl- oder -ethyl-Gruppe; oder auch Haloalkyl-Derivate der entsprechenden Gruppen wie beispielsweise Haloalkyl-, Haloalkoxyalkyl-, Alkoxy-haloalkyl-, Haloalkyl-cycloalkyl- oder Halocycloalkyl-Reste.

Die oben gegebene Erläuterung gilt entsprechend für Reste ohne konkrete Angabe der Anzahl an C-Atomen, sowie für Homologe bzw. deren abgeleitete Reste.

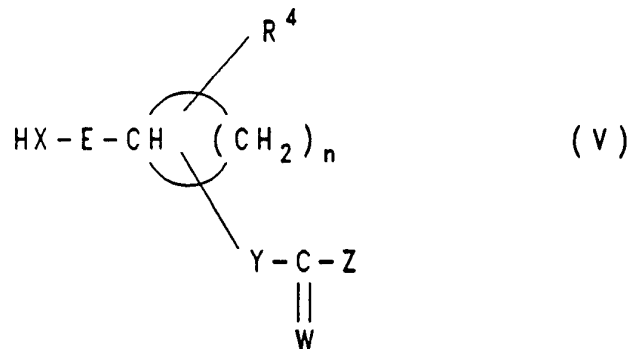
Die vorliegende Erfindung betrifft die Verbindungen der Formel I in Form der freien Base oder eines Säureadditionssalzes. Säuren, die zur Salzbildung herangezogen werden können, sind anorganische Säuren, wie Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder organische Säuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Malonsäure, Oxalsäure, Fumarsäure, Adipinsäure, Stearinsäure, Ölsäure, Methansulfonsäure, Benzolsulfonsäure oder Toluolsulfonsäure.

Neben der erwähnten cis/trans-Isomere an der Cycloalkyl-Gruppe weisen die Verbindungen der Formel I zum Teil ein oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome oder Stereoisomere an Doppelbindungen auf. Es können daher Enantiomere oder Diastereomere auftreten. Die Erfindung umfaßt sowohl die reinen Isomeren als auch deren Gemische. Die Gemische von Diastereomeren können nach gebräuchlichen Methoden, z.B. durch selektive Kristallisation aus geeigneten Lösungsmitteln oder durch Chromatographie in die Komponenten aufgetrennt werden. Racemate können nach üblichen Methoden in die Enantiomeren aufgetrennt werden, so z.B. durch Salzbildung mit einer optisch aktiven Säure, Trennung der diastereomeren Salze und Freisetzung der reinen Enantiomeren mittels einer Base.

Die Erfindung betrifft weiterhin ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, das dadurch gekennzeichnet ist, daß man eine Verbindung der Formel IV



worin A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und L eine Abgangsgruppe, beispielsweise Halogen, Alkylthio, Alkylsulfonyloxy oder Arylsulfonyloxy, Alkylsulfonyl oder Arylsulfonyl bedeutet, mit einem Nucleophil der Formel V



worin X, E, R<sup>4</sup>, n, Y, W und Z die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt und die so oder auf andere Weise erhaltenen Verbindungen der Formel I, falls R<sup>3</sup> Wasserstoff bedeutet, gegebenenfalls in der Position 5 des Heterocyclus halogeniert, vorzugsweise chloriert oder bromiert.

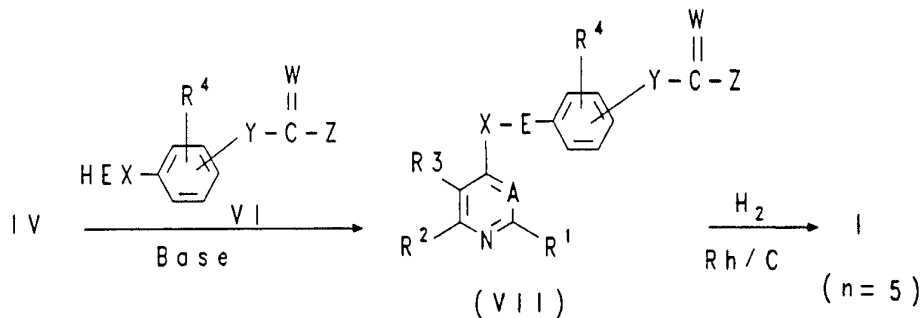
Die oben beschriebene Substitutionsreaktion ist im Prinzip bekannt. Die Abgangsgruppe Z ist in weiten Grenzen variierbar und kann beispielsweise ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom oder Iod bedeuten oder Alkylthio wie Methyl- oder Ethylthio, oder Alkylsulfonyloxy wie Methan-, Trifluormethan- oder Ethansulfonyloxy oder Arylsulfonyloxy, wie Benzolsulfonyloxy oder Toluolsulfonyloxy oder Alkylsulfonyl wie Methyl- oder Ethylsulfonyl oder Arylsulfonyl wie Phenyl- oder Toluolsulfonyl.

Die vorgenannte Reaktion wird in einem Temperaturbereich von 20-150°C, zweckmäßig in Anwesenheit einer Base und gegebenenfalls in einem inerten organischen Lösungsmittel wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidin-2-on, Dioxan, Tetrahydrofuran, 4-Methyl-2-pentanone, Methanol, Ethanol, Butanol, Ethylenglykol, Ethylenglykoldimethylether, Toluol, Chlorbenzol oder Xylol durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Geeignete Basen für den Fall, daß X Sauerstoff bedeutet, sind beispielsweise Alkali- oder Erdalkalimetallcarbonate, -hydrogencarbonate, -amide oder -hydride wie Natriumcarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Kaliumcarbonat, Natriumamid oder Natriumhydrid, für den Fall, daß X NH bedeutet, sind dies beispielsweise Alkali- oder Erdalkalimetallcarbonate, -hydrogencarbonate, -hydroxide, -amide oder -hydride wie Natriumcarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Kaliumcarbonat, Natriumhydroxid, Natriumamid oder Natriumhydrid oder organische Basen wie Triethylamin oder Pyridin. Auch ein zweites Äquivalent eines Amins V kann als Hilfsbase eingesetzt werden.

Die Erfindung betrifft weiterhin ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I für die n die Zahl 5 bedeutet, insbesondere von Derivaten des Pyridins für die E eine direkte Bindung bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel IV mit einem Nucleophil der Formel VI zu einer Verbindung der Formel VII umsetzt und aus letzterer durch Hydrierung des Phenylrestes die Verbindungen I erhält.

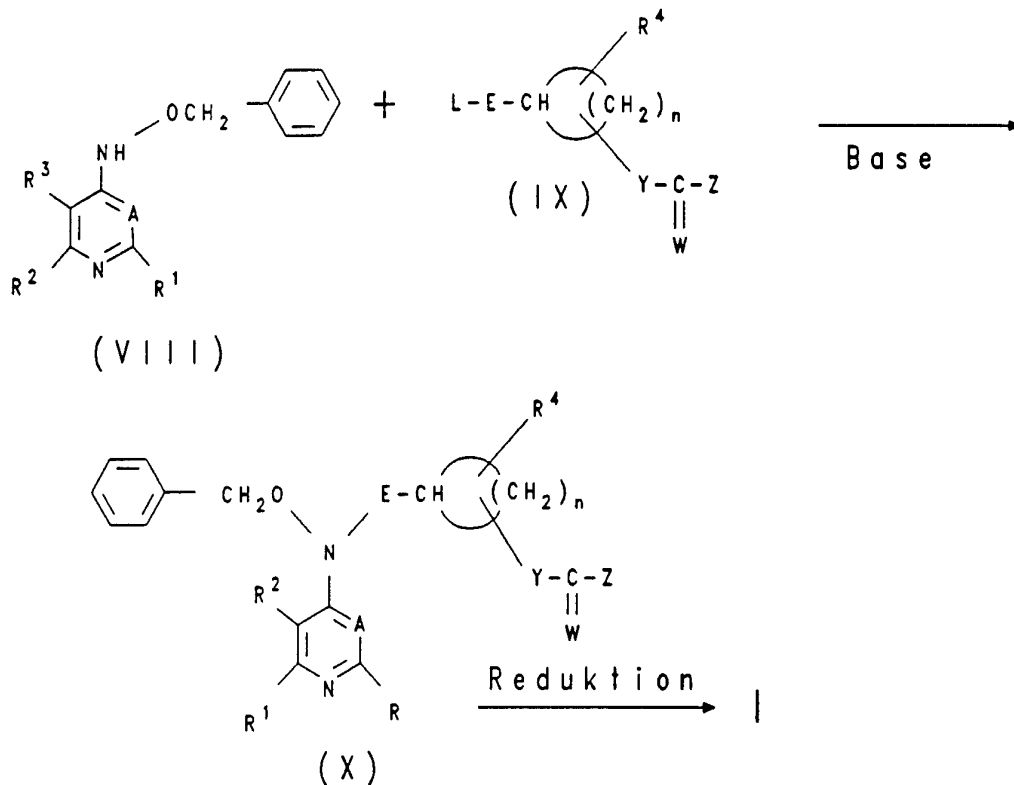
21



Die Umsetzung zu den Verbindungen VII erfolgt analog der Darstellung der Verbindungen der Formel I aus den Edukten IV und V. Die Hydrierung von VII erfolgt nach bekannten Methoden (vgl. z.B. F. Zymalkowski, Katalytische Hydrierungen, S. 191, Enke Verlag, Stuttgart, 1965) und führt zu cis/trans-Gemischen an der Cyclohexyl-Seitenkette die durch Kristallisation oder Chromatographie getrennt werden können.

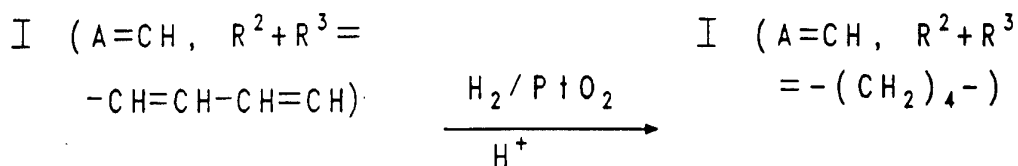
Die Erfindung betrifft weiterhin ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, für die X NH bedeutet, insbesondere von Derivaten des Pyridins, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel VIII, in der R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und A die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Alkylierungsmittel der Formel IX, in der E, n, R<sup>4</sup>, Y, W und z die zur Formel I angegebenen Bedeutungen haben und L eine Abgangsgruppe mit der zu Formel IV angegebenen Bedeutung ist, zu einer Verbindung der Formel X umsetzt und letztere anschließend reduktiv in die Verbindungen der Formel I umwandelt.

22



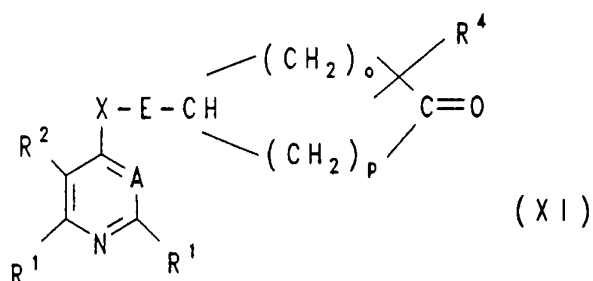
Die Alkylierung zu den Verbindungen der Formel X erfolgt dabei analog der Darstellung der Verbindungen der Formel I aus den Verbindungen der Formel IV. Die reduktive Spaltung der Zwischenprodukte X erfolgt analog bekannten Methoden (vgl. R. Huisgen et al. B. 101, 2559 (1968), C.H. Rayburn, W. R. Harlau, H.R. Haumer Am. Soc. 72, 1721 (1950)). Die Herstellung der Edukte VIII ist in DOS 4 331 179 beschrieben.

Gegenstand der Erfindung ist weiterhin ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I für die A CH bedeutet und R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen an die sie gebunden sind einen gesättigten 6-gliedrigen Ring bilden (5,6,7,8-Tetrahydrochinoline), dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel I, für die A CH bedeutet und R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen an die sie gebunden sind, einen ungesättigten 6-gliedrigen Ring bilden (Chinoline) in Gegenwart eines Edelmetallkatalysators hydriert.

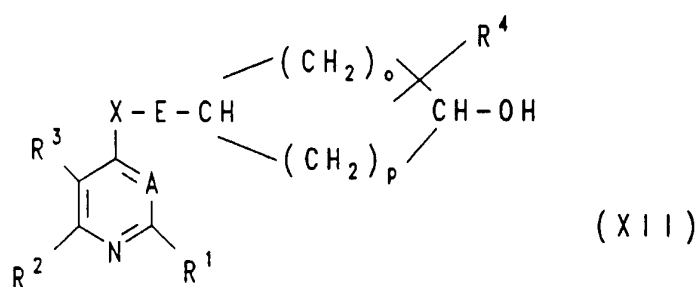


Die Hydrierung erfolgt analog bekannter Methoden (vgl. J.Z. Ginos, J. Org. Chem. 40, 1191, (1975)).

Gegenstand der Erfindung ist weiterhin ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I für die Y Sauerstoff bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel XI



für die A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X und E die zur Formel I angegebenen Bedeutungen haben und die Summe der Indices o und p gleich der Zahl (n-1) ist, wobei n die zur Formel I angegebene Bedeutung hat, mit einem geeigneten Reduktionsmittel zu einer Verbindung der Formel XII reduziert



für die R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, E und A die zur Formel I angegebenen Bedeutungen haben und o und p die zur Formel XI angegebene Bedeutung haben und diese Verbindung der Formel XII anschließend mit einem Acylierungsmittel der allgemeinen Formel L-C-Z in der W und Z die zur Formel I angegebenen



Bedeutungen hat und L eine Abgangsgruppe mit den zur Formel IV angegebenen Bedeutungen ist, an der OH-Gruppe acyliert.

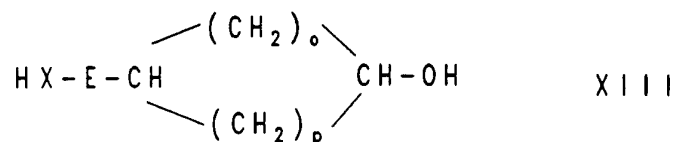
Die Reduktion der Verbindungen XI zu den Verbindungen XII erfolgt in Analogie zu bekannten Verfahren. Bevorzugte Reduktionsmittel sind komplexe Hydride wie Lithiumaluminiumhydrid, Natriumborhydrid und im Falle der Cyclohexyl-Derivate komplexe Hydride mit voluminösen Substituenten am Zentralatom wie z.B. Lithium-tri-sec.-butylborhydrid (L-Selectride®) oder Lithium-trisiamylborhydrid (LS-Selectride®) die bei der Reduktion die bevorzugten Derivate mit cis-Konfiguration bezüglich der 1,4-Substituenten ergeben.

Die anschließende Acylierungsreaktion erfolgt analog bekannter Methoden zur Veresterung von Alkoholen mit aktivierten Carbonsäure-Derivaten, indem man z.B. die Verbindungen XII mit einem Carbonsäurechlorid Z-C-Cl in einem



inerten Lösemittel wie Dichlorethan, Trichlorethan, Ether oder Tetrahydrofuran in Gegenwart einer Base wie z.B. Triethylamin oder Pyridin umsetzt oder auch die Base selbst (Pyridin) als Lösemittel verwendet.

Gegenstand der Erfindung ist weiterhin ein Verfahren zur Herstellung der Zwischenprodukte der Formel XII, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der allgemeinen Formel IV mit einem Nucleophil der allgemeinen Formel XIII umsetzt

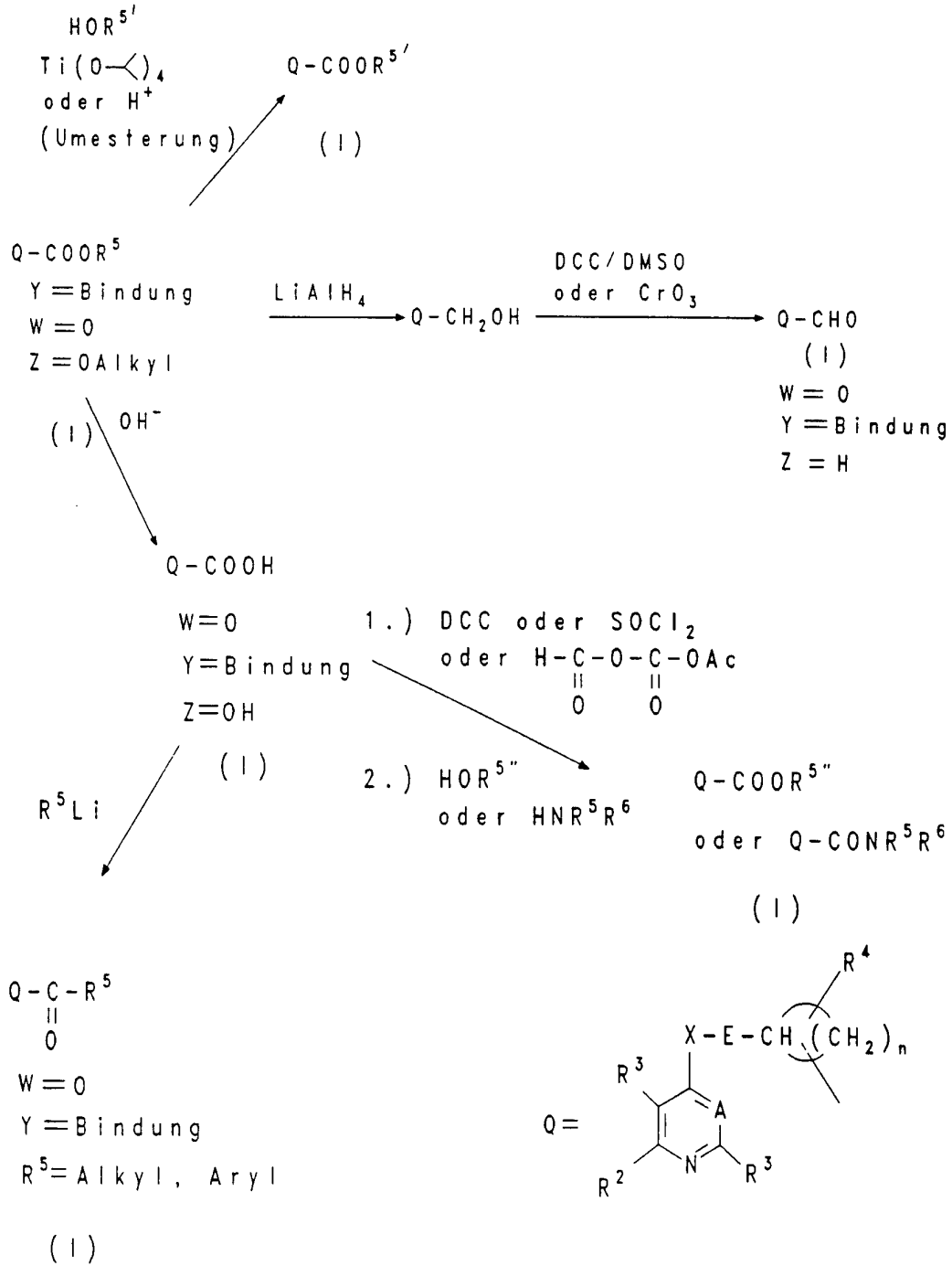


in der X, E, o und p die zur Formel XIII angegebenen Bedeutungen haben. Die Umsetzung erfolgt analog der Darstellung der Verbindungen I aus den Edukten der Formeln IV und V.

Die nach den oben beschriebenen Verfahren synthetisierten Verbindungen der Formel I können aus der Gruppierung -Y-C-Z nach bekannten Methoden



weiter abgewandelt werden, insbesondere für den Fall, daß Y eine direkte Bindung, W Sauerstoff und Z OR<sup>5</sup> bedeutet (Carbonsäureester).



Die beschriebenen Umsetzungen erfolgen analog bekannten Verfahren

Umesterung: D. Seebach et al., Synthesis 1982, 138,

Alkohol-Oxidation: K. E. Pfitzner, J. G. Moffat, J. Amer. Chem. Soc. 87, 5661 (1965).

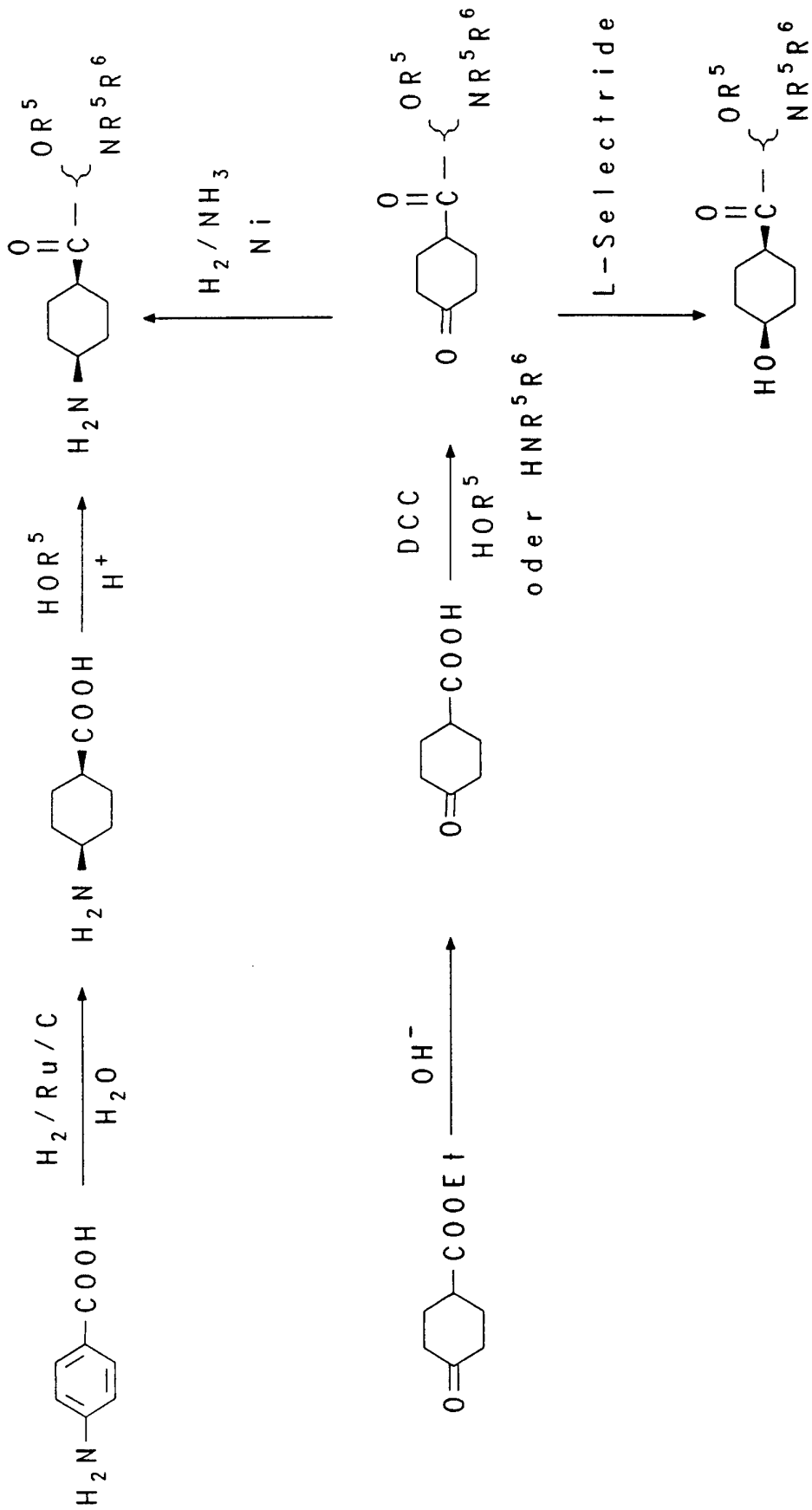
Überführung von Carbonsäuren in Ketone: M. J. Jorgenson, Org. Reactions 18, 1 (1970).

Die als Ausgangsprodukte benötigten Nucleophile der Formel V können für den Fall, daß X Sauerstoff bedeutet, nach bekannten Verfahren hergestellt werden, beispielsweise durch Reduktion einer Carbonylgruppe mit einem geeigneten Reduktionsmittel, beispielsweise einem komplexen Metallhydrid oder im Falle eines Aldehyds oder Ketons auch mit Wasserstoff und einem Hydrierkatalysator. Zur Darstellung von Cyclohexanol-Derivaten können auch geeignete substituierte Phenole mit Wasserstoff in Gegenwart eines Hydrierkatalysators umgesetzt werden.

Die als Ausgangsprodukte benötigten Nucleophile der Formel V können für den Fall, daß X NH bedeutet, nach bekannten Verfahren hergestellt werden, beispielsweise durch Reduktion eines Oxims oder eines Nitrils mit einem geeigneten Reduktionsmittel, beispielsweise einem komplexen Metallhydrid oder Wasserstoff in Gegenwart eines Hydrierkatalysators, reduktive Aminierung oder Leuckart-Wallach-Reaktion eines Aldehyds oder Ketons oder Gabriel-Reaktion eines Alkylhalogenids oder -Tosylats. Zur Darstellung von Cyclohexylamin-Derivaten können auch geeignete substituierte Aniline mit Wasserstoff in Gegenwart eines Hydrierkatalysators umgesetzt werden.

Zur Herstellung der Edukte für die besonders bevorzugten Cyclohexyl-Derivate kommen insbesondere folgende Umsetzungen in Frage:

27



Herstellung der Edukte:

cis-4-Aminocyclohexancarbonsäuremethylester

L.H. Werner, S. Ricca, J. Amer. Chem. Soc. 80, 2733 (1958).

Cyclohexanon-4-carbonsäureethylester:

H. Musso, K. Naumann, K. Grychtul, Chem. Ber. 100, 3614 (1967).

Die Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren, Helminthen und Mollusken, ganz besonders bevorzugt zur Bekämpfung von Insekten und Spinnentieren, die in der Landwirtschaft, bei der Tierzucht, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Acarina z. B. *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp., *Eotetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Eutetranychus* spp..

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

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

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

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

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

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

Aus der Ordnung der Orthoptera z. B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

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

Aus der Ordnung der Anoplura z. B. *Phytoxera vastatrix*, *Pemphigus* spp.,  
*Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp..

Aus der Ordnung der Mallophaga z. B. *Trichodectes* spp., *Damalinea* spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z. B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

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

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

Aus der Ordnung der Lepidoptera z. B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus*  
*piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*,  
*Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chryorrhoea*, *Lymantria*  
spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp.,  
*Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Laphygma exigua*, *Mamestra*  
*brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*,  
*Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia*  
*kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*,  
*Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix*  
*viridana*.

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

Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica.

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

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

Aus der Ordnung der Siphonaptera z. B. Xenopsylla cheopsis, Ceratophyllus spp..

Aus der Ordnung der Arachnida z. B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.

Aus der Klasse der Helminthen z. B. Haemonchus, Trichostrongylus, Ostertagia, Cooperia, Chabertia, Strongyloides, Oesophagostomum, Hyostrongylus, Ancylostoma, Ascaris und Heterakis sowie Fasciola und pflanzenschädigende Nematoden z. B. solche der Gattungen Meloidogyne, Heterodera, Ditylenchus, Aphelenchoides, Radopholus, Globodera, Pratylenchus, Longidorus und Xiphinema.

Aus der Klasse der Gastropoda z. B. Deroceras spp., Arion spp., Lymnaea spp., Galba spp., Succinea spp., Biomphalaria spp., Bulinus spp., Oncomelania spp..

Aus der Klasse der Bivalva z. B. Dreissena spp..

Die Erfindung betrifft auch Mittel, insbesondere insektizide und akarizide Mittel, die die Verbindungen der Formel I neben geeigneten Formulierungshilfsmitteln enthalten.

Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formel I im allgemeinen zu 1 bis 95 Gew.-%.

Sie können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem wie es durch die biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben ist.

Als Formulierungsmöglichkeiten kommen daher in Frage:

Spritzpulver (WP), emulgierbare Konzentrate (EC), wäßrige Lösungen (SL), Emulsionen, versprühbare Lösungen, Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis (SC), Suspoemulsionen (SE), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln, Wachse oder Köder.

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in:

Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986; van Valkenburg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in:

Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1967; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z. B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix. Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Netzmittel, z. B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder

Alkylphenol-sulfonate und Dispergiermittel, z. B. ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium enthalten.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel, z. B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Cadodecylbenzol-sulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykoether, Fettalkoholpolyglykoether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanfettsäureester, Polyoxyethylensorbitan-Fettsäureester oder Polyoxyethylensorbitester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z. B. Talkum, natürlichen Tonen wie Kaolin, Bentonit, Pyrophyllit oder Diatomeenerde. Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z. B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z. B. etwa 10 bis 90 Gew.-% der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen etwa 2 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z. B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser. Staubförmige und granuliert Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit u. a. variiert die erforderliche Aufwandmenge. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z. B. zwischen 0,0005 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,001 und 5 kg/ha.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischungen mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen.

Zu den Schädlingsbekämpfungsmitteln zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, Formamidine, Zinnverbindungen, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u. a.. Bevorzugte Mischungspartner sind

1. aus der Gruppe der Phosphorverbindungen  
Acephate, Azamethiphos, Azinphos-ethyl-, Azinphosmethyl, Bromophos, Bromophos-ethyl, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifosmethyl, Demeton, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methyl sulfphon, Dialifos, Diazinon, Dichlorvos, Dicrotophos, O,O-1,2,2,2-Tetrachlorethylphosphorthioate

(SD 208 304), Dimethoate, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Etrinfos, Famphur, Fenamiphos, Fenitrothion, Fensulfothion, Fenthion, Fonofos, Formothion, Heptenophos, Isazophos, Isothioate, Isoxathion, Malathion, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Salithion, Mevinphos, Monocrotophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton-methyl, Parathion, Parathion-methyl, Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosfolan, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimiphos, Primiphos-ethyl, Pirimiphos-methyl, Profenofos, Propaphos, Proetamphos, Prothiofos, Pyraclofos, Pyridaphenthion, Quinalphos, Sulprofos, Temephos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thiometon, Triazophos, Trichlorphon, Vamidothion;

2. aus der Gruppe der Carbamate

Aldicarb, 2-sec.-Butylphenylmethylcarbamate (BPMC), Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Cloethocarb, Benfuracarb, Ethiofencarb, Furathiocarb, Isoprocarb, Methomyl, 5-Methyl-m-cumenylbutyryl(methyl)carbamate, Oxamyl, Pirimicarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, Ethyl-4,6,9-triaza-4-benzyl-6, 10-dimethyl-8-oxa-7-oxo-5, 11-dithia-9-dodecenoate (OK 135), 1-Methylthio(ethylideneamino)-N-methyl-N-(morpholinio)thio)carbamate (UC 51717);

3. aus der Gruppe der Carbonsäureester

Allethrin, Alphametrin, 5-Benzyl-3-furylmethyl-(E)-(1R)-cis, 2,2-di-methyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl)cyclopropanecarboxylate, Bioallethrin, Bioallethrin((S)-cyclopentylisomer), Bioresmethrin, Biphenate, (RS)-1-Cyano-1-(6-phenoxy-2-pyridyl)methyl-(1RS)-trans-3-(4-tert.butylphenyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (NCI 85193), Cycloprothrin, Cyhalothrin, Cythithrin, Cypermethrin, Cyphenothrin, Deltamethrin, Empenthrin, Esfenvalerate, Fenfluthrin, Fenpropathrin, Fenvalerate, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvalinate (D-Isomer), Permethrin, Phenothrin ((R)-Isomer), d-Pralethrin, Pyrethrine (natürliche Produkte), Resmethrin, Tefluthrin, Tetramethrin, Tralomethrin;

## 4. aus der Gruppe der Amidine

Amitraz, Chlordimeform;

## 5. aus der Gruppe der Zinnverbindungen

Cyhexatin, Fenbutatinoxide;

## 6. Sonstige

Abamectin, Bacillus thuringiensis, Bensultap, Binapacryl, Bromopropylate, Buprofezin, Camphechlor, Cartap, Chlorobenzilate, Chlorfluazuron, 2-(4-Chlorphenyl)-4,5-diphenylthiophen (UBI-T 930), Clorfentezine, Cyclopropancarbonsäure-(2-naphthylmethyl)ester (Ro 12-0470), Cyromazin, N-(3,5-Dichlor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-1-propyloxy)phenyl)carbamoyle-2-chlorbenzcarboximidsäureethylester, DDT, Dicofol, N-(N-(3,5-Di-chlor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)phenylamino)carbonyl)-2,6-difluorbenzamid (XRD 473), Diflubenzuron, N-(2,3-Dihydro-3-methyl-1,3-thiazol-2-ylidene)-2,4-xylidine, Dinobuton, Dinocap, Endosulfan, Ethofenprox, (4-Ethoxyphenyl)(dimethyl)(3-(3-phenoxyphenyl)propyl)silan, (4-Ethoxyphenyl)(3-(4-fluoro-3-phenoxyphenyl)propyl)dimethylsilan, Fenoxycarb, 2-Fluoro-5-(4-(4-ethoxyphenyl)-4-methyl-1-pentyl)diphenylether (MTI 800), Granulose- und Kernpolyederviren, Fenthio carb, Flubenzimine, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Gamma-HCH, Hexythiazox, Hydramethylnon (AC 217300), Ivermectin, 2-Nitromethyl-4,5-dihydro-6H-thiazin (DS 52618), 2-Nitromethyl-3,4-dihydrothiazol (SD 35651), 2-Nitromethylene-1,2-thiazinan-3-ylcarbomaldehyde (WL 108477), Propargite, Teflubenzuron, Tetradifon, Tetrasul, Thiocyclam, Trifumuron, Imidacloprid.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann von 0,00000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,00001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Endo- und Ektoparasiten auf dem veterinärmedizinischen Gebiet bzw. auf dem Gebiet der Tierhaltung.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht hier in bekannter Weise wie durch orale Anwendung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Granulaten, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens (Dippen), Sprühens (Sprayen), Aufgießen (pour-on and spot-on) und des Einpuderns sowie durch parenterale Anwendung in Form beispielsweise der Injektion.

Die erfindungsgemäßen neuen Verbindungen der Formel I können demgemäß auch besonders vorteilhaft in der Viehhaltung (z. B. Rinder, Schafe, Schweine und Geflügel wie Hühner, Gänse usw.) eingesetzt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung werden den Tieren die neuen Verbindungen, gegebenenfalls in geeigneten Formulierungen (vgl. oben) und gegebenenfalls mit dem Trinkwasser oder Futter oral verabreicht. Da eine Ausscheidung im Kot in wirksamer Weise erfolgt, läßt sich auf diese Weise sehr einfach die Entwicklung von Insekten im Kot der Tiere verhindern. Die jeweils geeigneten Dosierungen und Formulierungen sind insbesondere von der Art und dem Entwicklungsstadium der Nutztiere und auch vom Befallsdruck abhängig und lassen sich nach den üblichen Methoden leicht ermitteln und festlegen. Die neuen Verbindungen können bei Rindern z. B. in Dosierungen von 0,01 bis 1 mg/kg Körpergewicht eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I zeichnen sich auch durch eine hervorragende fungizide Wirkung aus. Bereits in das pflanzliche Gewebe eingedrungene pilzliche Krankheitserreger lassen sich erfolgreich kurativ bekämpfen. Dies ist besonders wichtig und vorteilhaft bei solchen Pilzkrankheiten, die nach eingetretener Infektion mit den sonst üblichen Fungiziden nicht mehr wirksam bekämpft werden können. Das Wirkungsspektrum der beanspruchten Verbindungen erfaßt verschiedene

wirtschaftlich bedeutende, phytopathogener Pilze, wie z. B. *Plasmopara viticola*, *Erysiphe graminis* und *Puccinia recondita*.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen eignen sich daneben auch für den Einsatz in technischen Bereichen, beispielsweise als Holzschutzmittel, als Konservierungsmittel in Anstrichfarben, in Kühlschmiermittel für die Metallbearbeitung oder als Konservierungsmittel in Bohr- und Schneidölen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen entweder allein oder in Kombination mit weiteren, literaturbekannten Fungiziden angewendet werden.

Als literaturbekannte Fungizide, die erfindungsgemäß mit den Verbindungen der Formel I kombiniert werden können, sind z.B. folgende Produkte zu nennen: Aldimorph, Andoprim, Anilazine, BAS 480F, BAS 450F, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Binapacryl, Bitertanol, Bromuconazol, Buthiobate, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, CGA 173506, Cyprofuram, Dichlofluanid, Diclomezin, Diclobutrazol, Diethofencarb, Difenconazol (CGA 169374), Difluconazole, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazole, Dinocap, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Edifenfos, Ethirimol, Etridiazol, Fenarimol, Fenfuram, Fencpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetate, Fentinhydroxide, Ferimzone (TF164), Fluazinam, Fluobenzimine, Fluquinconazole, Fluorimide, Flusilazole, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetylaluminium, Fuberidazole, Fulsulfamide (MT-F 651), Furalaxyl, Furconazol, Furmecyclox, Guazatine, Hexaconazole, ICI A5504, Imazalil, Imibenconazole, Iprobenfos, Iprodione, Isoprothiolane, KNF 317, Kupferverbindungen wie Cu-oxychlorid, Oxine-Cu, Cu-oxide, Mancozeb, Maneb, Mepanipyrim (KIF 3535), Metconazol, Mepronil, Metalaxyl, Methasulfocarb, Methfuroxam, MON 24000, Myclobutanil, Nabam, Nitrothalidopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxycarboxin, Penconazol, Pencycuron, PP 969, Probenazole, Propineb, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propiconazol, Prothiocarb, Pyracarbolid, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyroquilon, Rabenzazole, RH7592, Schwefel, Tebuconazole, TF 167, Thiabendazole, Thicyofen, Thiofanatemethyl,

Thiram, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Tricyclazole, Tridemorph, Triflumizol, Triforine, Validamycin, Vinchlozolin, XRD 563, Zineb, Natriumdodecylsulfonate, Natrium-dodecyl-sulfat, Natrium-C13/C15-alkohol-ethersulfonat, Natrium-cetostearyl-phosphatester, Dioctyl-natrium-sulfosuccinat, Natrium-isopropyl-naphthalenesulfonat, Natrium-methylenebisanththalene-sulfonat, Cetyl-trimethyl-ammoniumchlorid, Salze von langkettigen primären, sekundären oder tertiären Aminen, Alkyl-propyleneamine, Lauryl-pyrimidiniumbromid, ethoxylierte quarternierte Fettamine, Alkyl-dimethyl-benzyl-ammoniumchlorid und 1-Hydroxyethyl-2-alkyl-imidazolin.

Die oben genannten Kombinationspartner stellen bekannte Wirkstoffe dar, die zum großen Teil in Ch.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 7. Auflage (1983), British Crop Protection Council beschrieben sind.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren, die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen. Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Nachfolgende Beispiele dienen zur Erläuterung der Erfindung

#### I. Formulierungsbeispiele

- a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile Wirkstoff und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gew.-Teile Wirkstoff, 65 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoilylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.

- c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat stellt man her, indem man 40 Gew.-teile Wirkstoff mit 7 Gew.-Teilen eines Sulfobernsteinsäurehalbesters, 2 Gew.-Teilen eines Ligninsulfonsäure-Natriumsalzes und 51 Gew.-Teilen Wasser mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- d) Ein emulgierbares Konzentrat läßt sich herstellen aus 15 Gew.-Teilen Wirkstoff, 75 Gew.-Teilen Cyclohexan als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertem Nonylphenol (10 AeO) als Emulgator.
- e) Ein Granulat läßt sich herstellen aus 2 bis 15 Gew.-Teilen Wirkstoff und einem inerten Granulatträgermaterial wie Attapulgit, Bimsgranulat und/oder Quarzsand. Zweckmäßigerweise verwendet man eine Suspension des Spritzpulvers aus Beispiel b) mit einem Feststoffanteil von 30 % und spritzt diese auf die Oberfläche eines Attapulgitgranulats, trocknet und vermischt innig. Dabei beträgt der Gewichtsanteil des Spritzpulvers ca. 5 % und der des inerten Trägermaterials ca. 95 % des fertigen Granulats.

## II. Biologische Beispiele

### Fungizide Wirkung

#### Beispiel 1: *Plasmopara viticola*

Weinsämlinge der Sorten "Riesling/Ehrenfelder" wurden ca. 6 Wochen nach der Aussaat mit wäßrigen Suspensionen der beanspruchten Verbindungen tropfnaß behandelt. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer Zoosporangiensuspension von *Plasmopara viticola* inokuliert und tropfnaß für 4 bis 5 h in eine Klimakammer mit 23°C und 80 bis 90 % rel. Luftfeuchte gestellt.

Nach einer Inkubationszeit von 7 Tagen im Gewächshaus wurden die Pflanzen nochmals über Nacht in die Klimakammer gestellt, um die Sporulation des Pilzes anzuregen. Anschließend erfolgte die Befallsauswertung. Der Befallsgrad wurde in % befallener Blattfläche im Vergleich zu den unbehandelten, zu 100 % infizierten Kontrollpflanzen ausgedrückt.

Bei 250 mg Wirkstoff/l Spritzbrühe zeigen die folgenden Substanzen eine vollständige Befallsunterdrückung:

Beispiel Nr. 82, 83.

Beispiel 2: *Puccinia recondita*

Weizen der Sorte "Jubilar" wurde im 2-Blatt-Stadium mit wäßrigen Suspensionen der beanspruchten Verbindungen tropfnaß behandelt.

Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Puccinia recondita* inokuliert. Die Pflanzen wurden für ca. 16 Stunden tropfnaß in eine Klimakammer mit 20°C und ca. 100 % rel. Luftfeuchte gestellt. Anschließend wurden sie in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von 22 bis 25°C und 50 bis 70 % rel. Luftfeuchte weiterkultiviert.

Nach einer Inkubationszeit von ca. 2 Wochen sporulierte der Pilz auf der gesamten Blattoberfläche der nicht behandelten Kontrollpflanzen (100 % Infektion), so daß eine Befallsauswertung der Versuchspflanzen vorgenommen werden konnte. Der Befallsgrad wurde in % befallener Blattfläche im Vergleich zu den unbehandelten, zu 100 % infizierten Kontrollpflanzen ausgedrückt.

Bei 250 mg/l Spritzbrühe zeigt die folgende Substanz eine vollständige Befallsunterdrückung:

Beispiel Nr. 82.

**Beispiel 3: Erysiphe graminis**

Gerstenpflanzen wurden im 3-Blattstadium mit Konidien des Gerstenmehltaus (*Erysiphe graminis* f. sp. hordei) stark inokuliert und in einem Gewächshaus bei 20°C und einer rel. Luftfeuchte von 90 bis 95 % aufgestellt. 24 Stunden nach Inokulation wurden die Pflanzen mit den in Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen in den angegebenen Wirkstoffkonzentrationen gleichmäßig benetzt. Nach einer Inkubationszeit von 10 Tagen wurden die Pflanzen auf Befall mit Gerstenmehltau untersucht. Der Befallsgrad wurde ausgedrückt in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, zu 100 % infizierte Kontrollpflanzen.

Bei 250 mg Wirkstoff/l Spritzbrühe zeigen die folgenden Substanzen eine vollständige Befallsunterdrückung:

Beispiel Nr. 82, 83, 68.

**Insektizide Wirkung****Beispiel 4:**

Junge Reispflanzen (*Oryza sativa*) wurden in wässrige Verdünnungen eines Spritzpulverkonzentrates mit einer Konzentration von 250 ppm (bezogen auf Wirkstoff) getaucht und diese nach dem Abtropfen mit L4-Larvenstadien der Braunrückigen Reiszikade *Nilaparvata lugens* besetzt.

Nach dem Einlegen in einen Versuchskäfig wurden diese bei 28°C und hoher Luftfeuchtigkeit 3 Tage lang beobachtet und die Sterblichkeit der Versuchstiere bestimmt.

Bei 250 ppm erzeugten die Verbindungen gemäß Beispiel 70 und 82 eine 100 % Mortalität bei den Versuchstieren.

## Beispiel 5:

Larven (L3) des Southern Corn Rootworm (*Diabrotica undecimpunctata*) wurden auf Filterpapierscheiben gesetzt, die mit je 1 ml einer acetonigen Verdünnung eines Spritzpulvers in einer Konzentration von 250 ppm bezogen auf Wirkstoff getränkt waren. Nach dem Abdampfen des Acetons wurden die Schalen verschlossen, diese 3 Tage bei 28°C gelagert und danach die Mortalität der Larven bestimmt.

Bei den Verbindungen gemäß Beispiel 68, 70, 82, 98, 207 zeigte sich 100 % Mortalität.

## Beispiel 6

Petrischalen, die zur Hälfte mit einer Kunstfutterdiät ausgegossen waren, wurden mit L3-Larven des Ägyptischen Baumwollwurms *Spodoptera littoralis* besetzt und diese mit einer wäßrigen Suspension eines Spritzpulverkonzentrates, das 250 ppm Wirkstoff enthält, besprüht. Nach dem Verschließen der Schalen wurden diese nach 5 Tagen auf Mortalität der Larven hin untersucht.

Die Verbindungen gemäß Beispiel 70 und 82 zeigten 100 % Abtötung.

## Beispiel 7

Glaspetrischalen wurden an der Deckel- und Bodeninnenseite mit je 3 ml einer acetonigen Lösung des Spritzpulverkonzentrates mit 250 ppm Wirkstoffgehalt beschichtet und zum Abdampfen des Acetons 1 Stunde unter dem Abzug gehalten. Danach wurden die Schalen mit Imagines der Hausfliege (*Musca domestica*) besetzt, die Schalen verschlossen und nach 3 Stunden die Mortalität der Fliegen bestimmt.

Eine 100 % Abtötung konnte mit den Verbindungen gemäß Beispiel 66, 68, 70, 96, 98, 207 und 224 erzielt werden.

#### Beispiel 8

Mit Kundebohnenblattlaus (*Aphis craccivora*) stark besetzte Ackerbohnen (*Vicia faba*) wurden mit wäßrigen Verdünnungen von Spritzpulverkonzentraten mit 250 ppm Wirkstoffgehalt bis zum Stadium des beginnenden Abtropfens besprüht.

Die Mortalität der Blattläuse wurde nach 3 Tagen bestimmt.

Eine 100 %ige Abtötung konnte mit den Verbindungen gemäß Beispiel 68, 82 und 83 erzielt werden.

#### Beispiel 9

Mit Bohnenspinnmilben (*Tetranychus urticae*, Vollpopulation) stark befallene Bohnenpflanzen (*Phaseolus v.*) wurden mit der wäßrigen Verdünnung eines Emulsionskonzentrates, das 250 ppm des jeweiligen Wirkstoffes enthielt, gespritzt. Die Mortalität der Milben wurde nach 7 Tagen kontrolliert. 100 % Abtötung wurde mit den Verbindungen gemäß Beispiel 82, 83 und 96 erzielt.

#### Beispiel 10

Mit Weißer Fliege (*Trialeurodes vaporariorum*) stark besetzte Bohnenpflanzen wurden mit wäßrigen Suspensionen von Spritzpulverkonzentraten (250 ppm Wirkstoffgehalt) bis zum beginnenden Abtropfen gespritzt. Nach Aufstellung der Pflanzen im Gewächshaus erfolgte nach 14 Tagen die mikroskopische Kontrolle mit dem Ergebnis jeweils 100 %iger Mortalität bei den Präparaten mit den Wirkstoffen der Tabellenbeispiele 68 und 82.

## Beispiel 11

Larven (L4) der Schabe, *Blaberus craniifer*, wurden in Methanol gelöste Wirkstoffe injiziert.

Nach Applikation der Verbindungen gemäß Beispiel 66, 70, 207 und 224 ( $2 \times 10^{-4}$  g a.i./Tier) konnte nach 48 Stunden eine 100 %ige Mortalität festgestellt werden.

## Beispiel 12

Larven (L4) des Tabakswärmers, *Manduca sexta*, wurden in Aceton gelöste Wirkstoffe injiziert.

Nach Applikation der Verbindungen gemäß Beispiel 70 und 207 ( $2 \times 10^{-4}$  g a.i./Tier) konnte nach 48 Stunden eine 100 %ige Mortalität festgestellt werden.

## Verwendung als Antiparasitikum

## Beispiel 1

In vitro-Test an tropischen Rinderzecken (*Boophilus microplus*)

In folgender Versuchsanordnung ließ sich die Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Verbindungen gegen Zecken nachweisen:

Zur Herstellung einer geeigneten Wirkstoffzubereitung wurden die Wirkstoffe 10 %ig (G/V) in einer Mischung, bestehend aus Dimethylformamid (85 g), Nonylphenolpolyglykoether (3 g) und oxethyliertes Rizinusöl (7 g), gelöst und die so erhaltenen Emulsionskonzentrate mit Wasser auf eine Prüfkonzentration von 500 ppm verdünnt.

In diese Wirkstoffverdünnungen wurden jeweils zehn vollgesogene Weibchen der tropischen Zecke, *Boophilus microplus*, für fünf Minuten eingetaucht. Die Zecken wurden anschließend auf Filterpapier getrocknet und dann zum Zwecke der Eiablage mit der Rückseite auf einer Klebefolie befestigt. Die Aufbewahrung der Zecken erfolgte im Wärmeschrank bei 28°C und einer Luftfeuchtigkeit von 90 %.

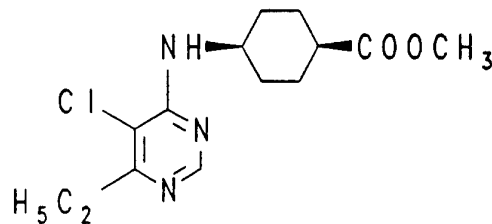
Zur Kontrolle wurden Zeckenweibchen lediglich in Wasser eingetaucht. Zur Bewertung der Wirksamkeit wurde zwei Wochen nach der Behandlung die Hemmung der Eiablage herangezogen. Dabei besagen 100 %, daß keine, 0 daß alle Zecken Eier abgelegt haben.

In diesem Test bewirkten die Verbindungen gemäß Beispiel 70 und 82 in einer Wirkstoffkonzentration von 500 ppm jeweils eine 100 %ige Hemmung der Eiablage.

### III. Herstellungsbeispiele

#### Beispiel A

#### 4-(cis-4-Methoxycarbonyl-cyclohexylamino)-5-chlor-6-ethyl-pyrimidin



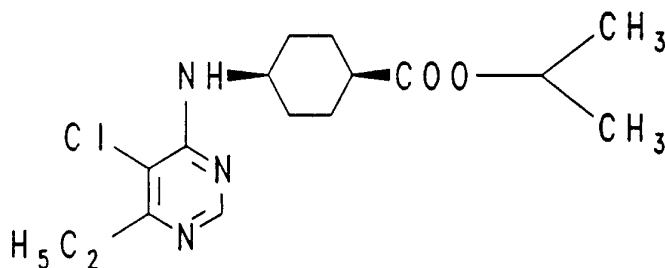
42,5 g (0,24 mol) 4,5-Dichlor-6-ethyl-pyrimidin, 37,5 g (0,24 mol) cis-4-Aminocyclohexancarbonsäuremethylester und 36,4 g (0,36 mol) Triethylamin werden ohne Lösungsmittel 6 h auf 80° erwärmt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird mit Wasser/Methylenchlorid aufgenommen und die organische Phase getrocknet und einrotiert. Man erhält 69 g eines braunen Öls (96,5 % d. Th.), das ohne weitere Reinigung weiter umgesetzt werden kann.

Zur weiteren Aufreinigung kann an Kieselgel mit Petrolether/Essigester 2:1 chromatographiert werden. Man erhält ein gelbes Öl, das beim Stehen kristallisiert.

Fp. 81-82°C.

#### Beispiel B

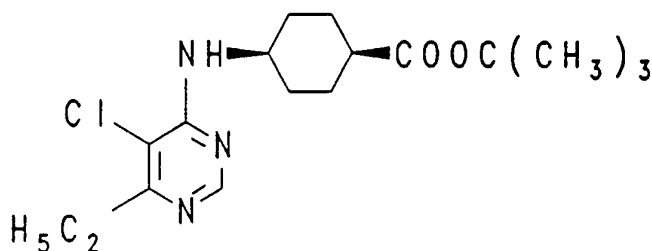
5-Chlor-6-ethyl-4-(cis-4-isopropoxycarbonyl-cyclohexylamino)-pyrimidin



1,5 g (5,0 mmol) Methylester aus Beispiel A und 500 mg Titan-IV-isopropylat werden in 50 ml Isopropanol 4 h unter Rückfluß erhitzt. Man zieht das Isopropanol ab und nimmt den Rückstand mit Wasser/Methylenchlorid auf. Nach Chromatographie an Kieselgel mit Petrolether/Ethylacetat 1:1 verbleiben 1,1 g farbloses Öl (67,5 % d. Th.), das beim Stehen kristalliniert (Fp. 85-86°).

#### Beispiel C

4-(cis-4-tert.-Butoxycarbonyl-cyclohexylamino)-5-chlor-6-ethyl-pyrimidin



3,5 g (0,02 mol) 4,5-Dichlor-6-ethyl-pyrimidin 4,0 g 4-Amino-cyclohexancarbonsäure-tert.-butylester (0,02 mol) und 3,0 g Triethylamin (0,03 mol) werden ohne Lösungsmittel 6 h auf 90° erwärmt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird mit Wasser/Methylenchlorid aufgenommen, die organische Phase getrocknet und eingeeengt. Zur Reinigung und zur Trennung der cis/trans-Isomeren wird an Kieselgel mit Petrolether/Ethylacetat 7:3 chromatographiert. Man erhält zunächst 1,0 g eines farblosen Öl (trans-Isomer) und nach einer Mischfraktion (1,0 g) 2,8 g cis-Isomer als farbloses Öl, das beim Stehen kristallisiert. Fp.: 87-88°C.

NMR-Daten:

trans-Isomer (CDCl <sub>3</sub> )	5,08 d NH
	4,00 m (breit) NH-CH
cis-Isomer (CDCl <sub>3</sub> )	5,19 d NH
	4,08 m (schmal) NH-CH

Herstellung der Vorstufen:

4-Amino-cyclohexancarbonsäure-tert.-butylester

10,3 g (52 mmol) 4-Cyclohexanoncarbonsäure-tert.-butylester werden in Gegenwart von 5 g Raney-Nickel in 200 ml Ammoniak-gesättigtem Methanol im Autoklaven bei 100°C und 100 bar hydriert. Nach Abfiltrieren vom Katalysator wird eingeeengt und der ölige Rückstand durch Destillation am Dünnschicht-Verdampfer (140°/0,5 mm) gereinigt. Man erhielt 5,7 g (55,1 % d. Th.) eines farblosen Öls (Gemisch der cis/trans-Isomeren).

## 4-Cyclohexanoncarbonsäure-tert.-butylester

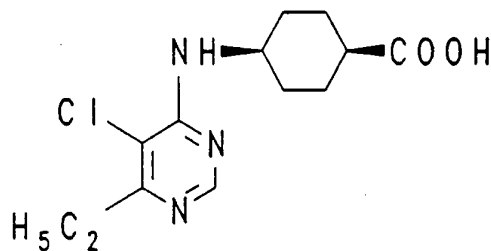
Zu einer Lösung von 27,7 g (0,2 mol) 4-Cyclohexanoncarbonsäure, 28,9 g tert.-Butanol und 24 g 4-Dimethylaminopyrimidin in 200 ml Methylenchlorid tropft man bei Raumtemperatur unter Rühren eine Lösung von 48,2 g Dicyclohexylcarbodiimid in 100 ml Methylenchlorid. Man rührt 24 h bei Raumtemperatur, filtriert vom Dicyclohexylharnstoff ab und rührt zwei Mal mit Wasser aus. Die organische Phase wird getrocknet und eingeeengt. Das Rohprodukt wird durch Destillation am Dünnschichtverdampfer gereinigt (150°/0,4 mm). Man erhält 20 g (51,8 % d. Th.) eines farblosen Öls.

## 4-Cyclohexanoncarbonsäure

33,5 g (0,21 mol) 4-Cyclohexanoncarbonsäure-methylester (Chem. Ber. 100, 3614 (1967)) werden in 125 ml 8 %iger Natronlauge gerührt bis eine klare Lösung vorliegt. Es wird einmal mit Toluol ausgerührt und die Wasserphase mit konz. Salzsäure angesäuert. Da die Carbonsäure nicht ausfiel wurde das Wasser am Rotationsverdampfer abgezogen und der feste Rückstand mehrere Male mit Methylenchlorid extrahiert. Man erhielt 27,7 g (92,9 % d. Th.) eines farblosen Feststoffs, der ohne weitere Reinigung weiter umgesetzt wurde.

## Beispiel D

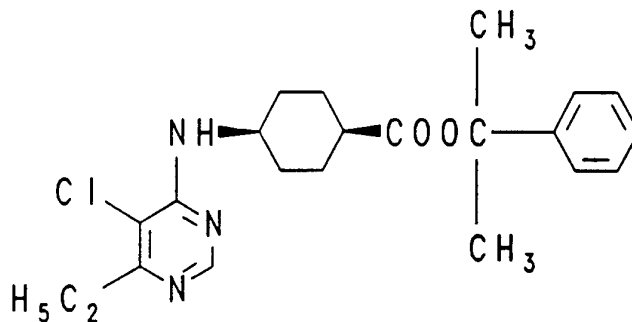
## cis-4-(5-Chlor-6-ethyl-pyrimidin-4-yl-amino)-cyclohexancarbonsäure



6,0 g (0,02 mol) Ester aus Beispiel A werden zu einer Lösung von 1,6 g (0,04 mol) Ätznatron in 50 ml Methanol gegeben und 8 h bei 50°C gerührt. Durch Zugabe von konz. Salzsäure wird auf pH 2 gebracht. Nach Abziehen des Lösungsmittels wird der feste Rückstand mehrere Male mit Methylenchlorid/Methanol 1:1 extrahiert und eingeengt. Es verbleiben 5,1 g (50 % d. Th.) eines farblosen Feststoffs. Fp.: > 255° Zers. (Hydrochlorid).

#### Beispiel E

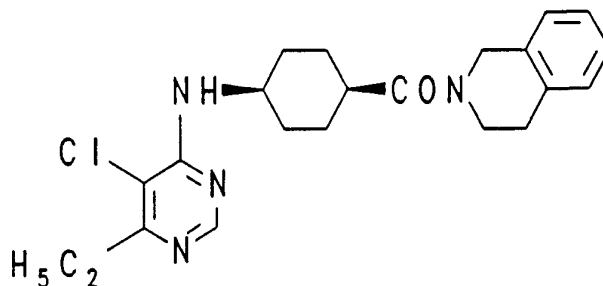
5-Chlor-6-ethyl-4-[cis-4-(2-phenyl-2-propoxycarbonyl)-cyclohexylamino]-pyrimidin



0,7 g (2,5 mmol) Carbonsäure aus Beispiel D werden mit 2 ml Thionylchlorid und 1 Tropfen Dimethylformamid bis zum Ende der Gasentwicklung gerührt. Man setzt 50 ml Toluol zu und zieht am Rotationsverdampfer ab. Dies wird einmal wiederholt. Es verbleibt ein farbloser Feststoff (Hydrochlorid des Carbonsäurechlorids) der in eine Lösung von 680 mg 2-Phenyl-2-propanol und 250 mg 4-Dimethylaminopyridin in 5 ml Pyridin eingetragen wird. Man erwärmt 2 h auf 60° und verdünnt nach Abkühlen auf Raumtemperatur mit 25 ml Wasser. Durch Zugabe von konz. Salzsäure wird schwach angesäuert und anschließend zwei Mal mit Methylenchlorid ausgerührt. Die vereinigten organischen Phasen werden getrocknet und eingeengt. Nach Chromatographie des Rohprodukts an Kieselgel mit Petrolether/Ethylacetat 7:3 verbleiben 150 mg (14,9 % d. Th.) eines farblosen Öls.

## Beispiel F

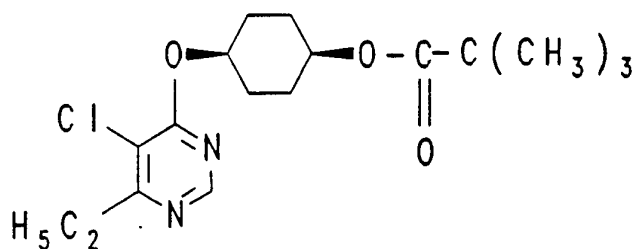
5-Chlor-6-ethyl-4-[cis-4-(1,2,3,4-tetrahydroisochinolin-2-yl-carbonyl)-cyclohexylamino]-pyrimidin



Aus 700 mg (2,5 mmol) Carbonsäure aus Beispiel D wird analog Beispiel E das Hydrochlorid des Carbonsäurechlorids hergestellt. Dieses wird in eine Lösung von 350 mg 1,2,3,4-Tetrahydroisochinolin und 500 mg Triethylamin in 25 ml Methylenchlorid eingetragen. Man rührt 4 h bei Raumtemperatur, rührt den Ansatz mit Wasser aus, trennt die organische Phase ab, trocknet und engt ein. Man erhält 0,7 g (70,2 % d. Th.) eines gelben Öls, das beim Stehen kristallisiert. Fp: 98-99°C.

## Beispiel G

5-Chlor-6-ethyl-4-(cis-4-pivaloyloxy-cyclohexyloxy)-pyrimidin

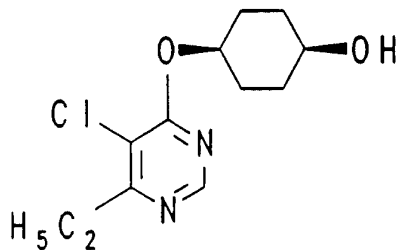


Zu einer Lösung von 0,85 g (3,3 mmol) 5-Chlor-6-ethyl-4-(cis-4-hydroxy-cyclohexyloxy)-pyrimidin in 10 ml Pyrimidin werden unter Kühlung 0,5 ml (4,2 mmol) Pivaloylchlorid zugetropft und bei Raumtemperatur bis zur vollständigen Umsetzung gerührt (ca. 1 h). Das Reaktionsgemisch wird im Vakuum bis zur Trocknen eingengt, mit Ether aufgenommen und mit verdünnter Ammoniumchloridlösung gewaschen. Die organische Phase wird über

Magnesiumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeengt. Die Reinigung des Rückstands erfolgt durch Flash-Chromatographie (Kieselgel, Petrolether/Ethylacetat = 6:4). Man erhält 0,6 g (53 %) Produkt als farblose Kristalle (Fp: = 62°C).

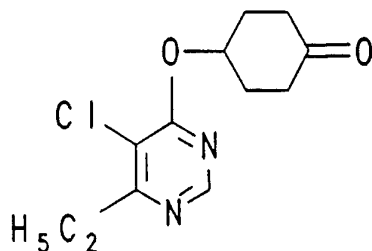
Herstellung der Vorstufen

5-Chlor-6-ethyl-4-(cis-4-hydroxy-cyclohexyloxy)-pyrimidin



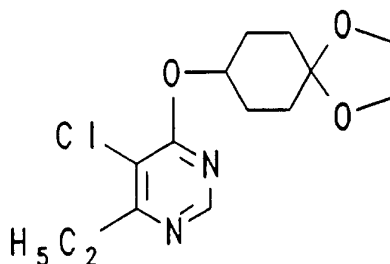
Zu einer Lösung von 10 g (39,2 mmol) 4-(5-Chlor-6-ethyl-pyrimidin-4-yloxy)-cyclohexanon in 200 ml Ethanol werden bei 0°C 410 mg (10,8 mmol) Natriumborhydrid zugegeben und bis zur vollständigen Umsetzung gerührt (ca. 6 h). Die Reaktionslösung wird im Vakuum eingeengt, der Rückstand mit 200 ml Ether aufgenommen und gründlich mit Wasser gewaschen. Die organische Phase wird über Magnesiumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeengt. Der Rückstand wird durch Flash-Chromatographie (Kieselgel, Petrolether/Ethylacetat = 6:4) gereinigt. Man erhält 3,5 g (35 %) cis-Isomeres (größerer R<sub>f</sub>-Wert) und 2,0 g (20 %) vom trans-Isomeren.

4-(5-Chlor-6-ethyl-pyrimidin-4-yloxy)-cyclohexanon



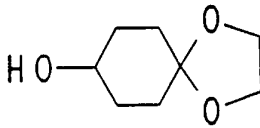
19 g (64 mmol) 5-Chlor-6-ethyl-(1,4-dioxaspiro[4,5]dec-8-yloxy)-pyrimidin werden in einer Mischung von 220 ml THF und 120 ml 2N HCl unter kräftigem Rühren 24 h bei Raumtemperatur suspendiert. Nach Zugabe von 100 ml Diethylether wird die wäßrige Phase abgetrennt und anschließend die organische Phase mit Natriumhydrogencarbonat neutralisiert. Die wäßrige Phase wird erneut abgetrennt, die organische Phase über Magnesiumsulfat getrocknet und im Vakuum eingengt. Der Rückstand wird durch Flash-Chromatographie (Kieselgel, Petrolether/Ethylacetat = 6:4) gereinigt. Man erhält 11,2 g (69 %) gelbliches Öl.

5-Chlor-6-ethyl-4-(1,4-dioxaspiro[4,5]dec-8-yloxy)-pyrimidin



Zu einer Lösung von 19 g (0,12 mol) 4-Hydroxy-cyclohexanon-ethylenacetal in 200 ml abs. THF werden 5 g (0,16 mol) 80 % Natriumhydrid gegeben und 1 h auf Rückfluß erhitzt. Danach kühlt man die Reaktionslösung auf Raumtemperatur ab und tropft 21,2 g (0,12 mol) 4,5-Dichlor-6-ethylpyrimidin zu. Die Reaktionsmischung wird weitere 2 h auf Rückfluß erhitzt. Zur Vernichtung von überschüssigem Natriumhydrid tropft man langsam 20 ml Isopropanol zu und rührt die noch warme Reaktionsmischung weitere 30 min. Anschließend werden 100 ml wäßrige Ammoniumchloridlösung zugegeben, die wäßrige Phase mit Ether extrahiert und die vereinigten organischen Phasen über Magnesiumsulfat getrocknet. Das Lösungsmittel wird im Vakuum bis zur Trockne eingengt. Man erhält 35,0 g (93 %) gelbes Öl. Das Rohprodukt kann ohne weitere Reinigung weiter umgesetzt werden.

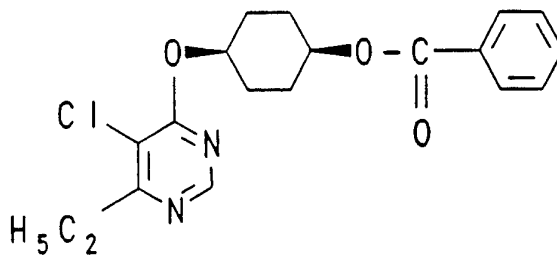
## 4-Hydroxy-cyclohexanon-ethylenketal



Zu einer Lösung von 50 g (0,252 mol) Cyclohexandionmonoethylenketal in 300 ml Ethanol werden 3,6 g (0,095 mol) Natriumborhydrid zugegeben und ca. 2 h bis zur vollständigen Umsetzung gerührt. Zur Vernichtung von überschüssigem Natriumborhydrid werden 30 ml Aceton zugetropft und nochmals 10 min gerührt. Danach werden unter kräftigem Rühren 50 ml H<sub>2</sub>O zugegeben und weitere 15 min gerührt. Das Reaktionsgemisch wird anschließend am Rotationsverdampfer eingeeengt und mit Diethylether aufgenommen. Die organische Phase wird mit Wasser gewaschen, über MgSO<sub>4</sub> getrocknet und eingeeengt. Nach gründlicher Trocknung erhält man 46 g (91 %) gelbliches Öl. Das so erhaltene Rohprodukt kann ohne weitere Reinigung weiter umgesetzt werden.

## Beispiel H

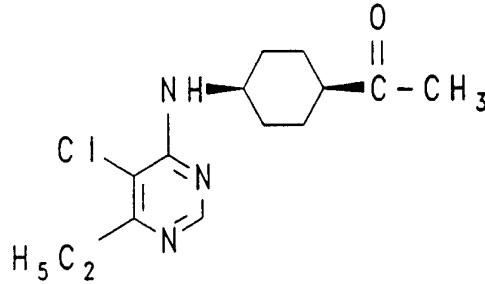
## 4-(cis-4-Benzoyloxy-cyclohexyloxy)-5-chlor-6-ethyl-pyrimidin



Hergestellt analog Beispiel G aus 1,0 g (3,9 mmol) 5-Chlor-6-ethyl-4-(cis-4-hydroxy-cyclohexyloxy)-pyrimidin und 0,6 g (4,3 mmol) Benzoylchlorid. Man erhält 0,93 g (63 % d. Th.) farblose Kristalle. Fp.: 69-71 °C

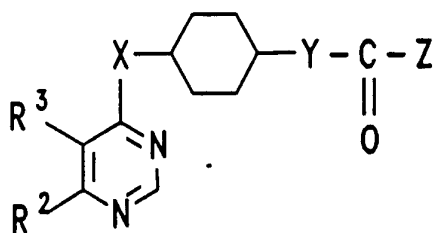
## Beispiel I

## 4-(4-Acetyl-cyclohexylamino)-5-chlor-6-ethyl-pyrimidin



Zu einer Suspension von 3,7 g Carbonsäure aus Beispiel D in 75 ml Tetrahydrofuran tropft man bei  $-10^{\circ}$ - $0^{\circ}$ C 25 ml einer 5 %igen Lösung von Methyllithium in Diethylether. Es bildet sich ein voluminöser farbloser Niederschlag. Man rührt 3 h bei Raumtemperatur nach, gießt auf Eis, gibt Toluol zu und trennt die organische Phase ab. Nach Trocknen und Einengen wird das Rohprodukt an Kieselgel mit Ethylacetat chromatographiert. Man eluiert zuerst das trans-Isomere (150 mg, Fp:  $99$ - $100^{\circ}$ C) dann das cis-Isomere (200 mg, Fp:  $78$ - $79^{\circ}$ C).

Tabelle 1



Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	H	
2	"	Br	"	-	"	H	
3	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	"	-	"	H	
4	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	H	
5	"	Cl	"	-	"	H	
6	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	H	
7	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	"	-	"	CH <sub>3</sub>	
8	"	Cl	"	-	"	"	78-79
9	"	Br	"	-	"	"	
10	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	"	-	"	"	
11	"	Br	"	-	"	"	
12	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
13	"	Cl	"	-	"	"	
14	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
15	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	"	-	"	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
16	"	Cl	"	-	"	"	
17	"	Br	"	-	"	"	
18	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
19	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	NH	-	cis	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
20	"	Cl	"	-	"	"	
21	"	Br	"	-	"	"	
22	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
23	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	"	-	"	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
24	"	Cl	"	-	"	"	
25	"	Br	"	-	"	"	
26	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
27	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
28	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
29	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
30	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
31	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	CHCH <sub>3</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
32	"	Br	"	-	"	"	
33	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
34	CH <sub>3</sub>	Cl	"	-	"	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
35	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	"	-	"	"	
36	"	Cl	"	-	"	"	
37	"	Br	"	-	"	"	
38	"	I	"	-	"	"	
39	Cyclopropyl	Cl	"	-	"	"	
40	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	"	"	-	"	"	
41	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	"	"	-	"	"	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
42	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Br	NH	-	cis	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
43	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
44	"	Cl	"	-	"	"	
45	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
46	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CN	"	-	"	"	
47	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-n C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	
48	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	Phenyl	
49	"	Br	"	-	"	"	
50	"	CN	"	-	"	"	
51	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	"		
52	"	Cl	"	-	"	"	
53	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	"	"	-	"	"	
54	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	"	"	-	"	"	
55	"	Br	"	-	"	"	
56	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
57	CH <sub>3</sub>	Cl	"	-	"	2-Thienyl	
58	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	"	"	-	"	"	
59	"	Br	"	-	"	"	
60	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	"	-	"	"	
61	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
62	"	Cl	"	-	"	"	
63	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
64	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OCH <sub>3</sub>	81-82

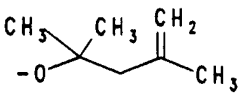
Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
65	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	OCH <sub>3</sub>	
66	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	79-80
67	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
68	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	O-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Öl
69	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
70	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	O-iC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	85-86
71	"	Br	"	-	"	"	
72	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	"	-	"	"	
73	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
74	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	NH	-	cis	O-iC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
75	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
76	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	
77	"	"	"	-	"	OCHCH <sub>3</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
78	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
79	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
80	CH <sub>3</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
81	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	"	-	"	"	
82	"	Cl	"	-	"	"	87-88
83	"	"	"	-	trans	"	Öl
84	"	Br	"	-	cis	"	
85	"	I	"	-	"	"	
86	"	CN	"	-	"	"	
87	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	"	-	"	"	


Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
88	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Br	NH	-	cis	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
89	Cyclopropyl	Cl	"	-	"	"	
90	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
91	"	Cl	"	-	"	"	
92	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
93	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
94	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
95	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	
96	"	"	"	-	"	OCH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	Öl
97	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
98	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	Öl
99	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
100	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
101	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
102	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OCHCH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Öl
103	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
104	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Öl
105	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
106	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cyclopropyloxy	
107	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
108	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cyclobutyloxy	
109	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
110	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cyclopentyloxy	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
111	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	Cyclopentyloxy	
112	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cyclohexyloxy	
113	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
114	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cycloheptyloxy	
115	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
116	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	cis-4-Methylcyclohexyloxy	
117	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
118	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	trans-4-Methylcyclohexyloxy	
119	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
120	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	1-Methylcyclohexyloxy	
121	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
122	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	cis-4-tert.-Butylcyclohexyloxy	
123	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	"	
124	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	trans-4-tert.-Butylcyclohexyloxy	
125	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
126	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	cis-4-Phenylcyclohexyloxy	
127	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
128	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	trans-4-Phenylcyclohexyloxy	
129	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
130	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	1-Methylcyclopentyl- oxy	Öl
131	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
132	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cyclopropylmethyl- oxy	
133	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
134	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cyclobutylmethoxy	
135	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
136	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cyclopentylmethyl- oxy	
137	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
138	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Cyclohexylmethoxy	
139	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
140	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	1- Methylcyclobutyloxy	
141	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
142	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	1,2,3,4-Tetrahydro- naphthalin-2-yloxy	
143	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	"	
144	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Decahydronaphthalin- 2-yloxy	
145	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
146	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Indan-2-yloxy	
147	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
148	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Tetrahydrofuran-2-yl- methoxy	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
149	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	Tetrahydrofuran-2-yl- methoxy	
150	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Tetrahydropyran-2-yl- methoxy	
151	"	"	"	-	"	2-Thienylmethoxy	
152	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
153	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OCH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
154	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
155	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
156	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
157	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
158	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
159	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	
160	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
161	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>	
162	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
163	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	
164	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
165	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	- OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	
166	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
167	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
168	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
169	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
170	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	
171	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡C-CH <sub>3</sub>	
172	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
173	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
174	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
175	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	
176	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
177	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"		
178	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
179	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
180	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
181	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
182	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
183	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
184	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
185	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	
186	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
187	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	
188	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
189	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclohexyl	
190	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclohexyl	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
191	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclobutyl	
192	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
193	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	- OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclopropyl	
194	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
195	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	- OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Cyclohexyl	
196	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
197	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
198	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
199	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	1-(2-Furanyl)-1-methyl-ethoxy	
200	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
201	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	"	1-(4-Biphenyl)-1-methyl-ethoxy	
202	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
203	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	1-(4-Fluorphenyl)-1-methyl-ethoxy	
204	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
205	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - 	
206	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
207	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	O	"	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	93-95
208	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	"	"	"	

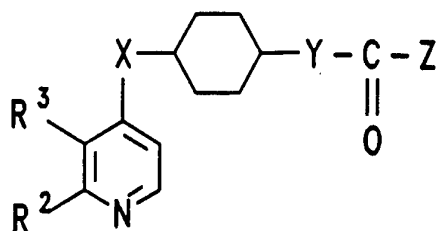
Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
209	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	O	"	"	"	62
210	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	O	cis	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
211	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	"	"	Cyclohexyl	
212	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	"	"	"	
213	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	O	O	cis	Cyclohexyl	50-54
214	"	"	NH	"	"	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
215	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	"	"	"	
216	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	O	"	"	"	61-63
217	"	"	NH	"	"	CCl <sub>3</sub>	
218	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	"	"	"	
219	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> Cl	Cl	O	"	"	"	96-97
220	"	"	"	"	"	CH <sub>3</sub>	65-68
221	"	"	NH	"	"	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
222	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	"	"	"	
223	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	O	"	"	"	69-71
224	"	"	NH	"	"	4-tert. Butylphenyl	Öl
225	"	"	"	"	trans	"	130-131
226	"	"	NH	-	cis	-N(CH <sub>3</sub> )(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )	
227	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
228	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-N(CH <sub>3</sub> )(n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub> )	
229	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
230	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-N(CH <sub>3</sub> )(tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )	
231	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
232	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	Morpholino	
233	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	-	cis	Morpholino	
234	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	4-Phenylpiperidino	
235	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
236	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	4-Benzylpiperidino	Harz
237	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
238	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	2-(1,2,3,4-Tetra- hydroisochinolyl	98-99
239	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
240	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	-N(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	97-99
241	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
242	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	N-(4-tert. Butyl- phenyl)-N-methyl- amino	
243	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
244	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OH	255° Zers. (Hydro- chlorid)
245	"	"	"	-	"	4-tert. Butylphenyl	
246	"	"	"	-	"	4-Trimethylsilyl- phenyl	
247	"	"	"	-	"	4-Methoxyphenyl	
248	"	"	"	-	"	4-Isopropoxyphenyl	
249	"	"	"	-	"	4-Fluorphenyl	

Bsp.-Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclohexan	Z	Fp. [°C]
250	"	"	"	-	cis	4-Trifluormethyl- phenyl	
251	"	"	"	-	cis	N-(4-Methylphenyl)- N-methyl-amino	118-120
252	"	"	"	-	"	1-((1,2,3,4-Tetra- hydrochinolyl	106-107

68

Tabelle 2

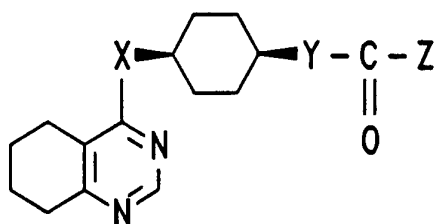


Bsp.- Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclo- hexan	Z	Fp. [°C]
275	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	H	
276	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	tert.Amyl	
277	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	"	-	"	"	
278	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
279	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Br	"	-	"	"	
280	"	"	"	-	"	2-Thienyl	
281	"	Cl	"	-	"	"	
282	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	"	"	-	"	"	
283	"	CH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
284	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
285	"	Br	"	-	"	"	
286	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	"	-	"	"	
287	"	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
288	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	4-tert.Butylphenyl	
289	"	Br	"	-	"	"	
290	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
291	"	"	"	-	"	"	

Bsp.- Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclo- hexan	Z	Fp. [°C]
292	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	tert.Amyloxy	
293	"	Br	"	-	"	"	
294	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
295	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	NH	-	cis	"	
296	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
297	"	Br	"	-	"	"	
298	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
299	"	Cl	"	-	"	"	
300	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	
301	"	Br	"	-	"	"	
302	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
303	"	Cl	"	-	"	"	
304	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclohexyl	
305	"	Br	"	-	"	"	
306	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
307	"	Cl	"	-	"	"	
308	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclopropyl	
309	"	Br	"	-	"	"	
310	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	"	-	"	"	
311	"	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
312	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	
313	"	Br	"	-	"	"	
314	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	

Bsp.- Nr.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	Y	Konfiguration am Cyclo- hexan	Z	Fp. [°C]
315	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	NH	-	cis	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	
316	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	
317	"	Br	"	-	"	"	
318	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
319	"	Cl	"	-	"	"	
320	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	NH	-	cis	4-Phenylpiperidino	
321	"	Br	"	-	"	"	
322	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	"	-	"	"	
323	"	"	"	-	"	"	
324	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	"	-	"	OH	

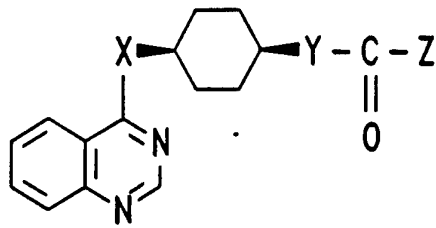
Tabelle 3



Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
325	O	-	H	
326	"	-	CH <sub>3</sub>	
327	"	-	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
328	"	-	Phenyl	
329	"	-	4-tert.Butylphenyl	
330	"	-	n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	
331	"	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
332	"	-	-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	
333	"	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
334	"	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	
335	"	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclohexyl	
336	"	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclopropyl	
337	"	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH = CH <sub>2</sub>	
338	"	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	
339	O	-	4-Phenylpiperidino	
340	"	-	1-Methylcyclopentyloxy	

Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
341	O	-	-OH	
342	"	-	-O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
343	"	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
344	"	-	2-(1,2,3,4-Tetrahydroiso- chinolyl)	
345	"	-	-N(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
346	"	-	4-Benzylpiperidino	

Tabelle 4



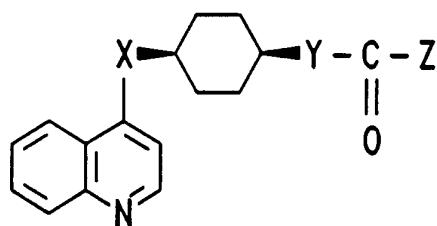
Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
350	O	-	H	
351	NH	-	H	
352	O	-	CH <sub>3</sub>	
353	NH	-	CH <sub>3</sub>	
354	O	-	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
355	NH	-	"	
356	O	-	nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	
357	NH	-	"	
358	O	-	Phenyl	
359	NH	-	"	
360	O	-	4-tert.Butylphenyl	
361	NH	-	"	
362	O	-	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
363	NH	-	"	
364	O	-	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	
365	NH	"	"	

Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
366	O	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
367	NH		"	
368	O		-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	
369	NH		"	
370	O		-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Cyclohexyl	
371	NH		"	
371 b	O		OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Cyclopropyl	
372	NH		"	
373	O	-	1-Methyl-cyclohexyloxy	
374	NH	-	"	
375	O	-	1-Methylcyclopentyloxy	
376	NH	-	"	
377	O	-	1-Methylcyclobutyloxy	
378	NH	-	"	
379	O	-	2-(1,2,3,4-Tetrahydro-naphthalin)-yloxy	
380	NH	-	"	
381	O	-	-O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
382	NH	-	"	
383	O	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>	
384	NH	-	"	

Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
385	O	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{COCH}_3$	
386	NH	-	"	
387	O	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{COC}_6\text{H}_5$	
388	NH	-	"	
389	O	-	$\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	
390	NH	-	"	
391	O	-	$\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	
392	NH	-	"	
393	O	-	$\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	
394	NH	-	"	
395	O	-	$\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	
396	NH	-	"	
397	O	-	OH	
398	NH	-	"	
399	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)_3$	
400	NH	-	"	
401	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{n}-\text{C}_8\text{H}_{17}$	
402	N	-	"	
403	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}_6\text{H}_5$	
404	NH	-	"	
405	O	-	N-(4-tert. Butylphenyl)-N-methyl-amino	

Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
406	NH	-	N-(4-tert. Butylphenyl)-N-methyl-amino	
407	O	-	2-(1,2,3,4-Tetrahydroiso-chinolin)-yl	
408	NH	-	"	
409	O	-	4-Phenylpiperidino	
410	NH	-	"	
411	O	-	4-Benzylpiperidino	
412	NH	-	"	

Tabelle 5



Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
421	O	-	H	
422	NH	-	H	
423	O	-	CH <sub>3</sub>	
424	NH	-	CH <sub>3</sub>	
425	O	-	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
426	NH	-	"	
427	O	-	nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	
428	NH	-	"	
429	O	-	Phenyl	
430	NH	-	"	
431	O	-	4-tert. Butylphenyl	
432	NH	-	"	
433	O	-	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
434	NH	-	"	
435	O	-	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	
436	NH	"	"	

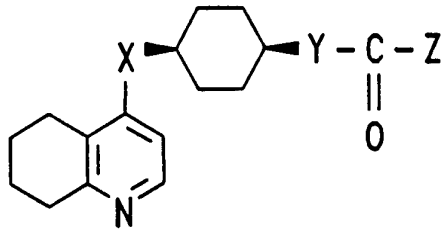
Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
437	O	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2 \text{C}_6\text{H}_5$	
438	NH		"	
439	O		$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	
440	NH		"	
441	O		$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2 \text{Cyclohexyl}$	
442	NH		"	
443	O		$\text{OC}(\text{CH}_3)_2 \text{Cyclopropyl}$	
444	NH		"	
445	O	-	1-Methylcyclohexyloxy	
446	NH	-	"	
447	O	-	1-Methylcyclopentyloxy	
448	NH	-	"	
449	O	-	1-Methylcyclobutyloxy	
450	NH	-	"	
451	O	-	2-(1,2,3,4-Tetrahydro-naphthalin)-yloxy	
452	NH	-	"	
453	O	-	$-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CF}_3$	
454	NH	-	"	
455	O	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{COOCH}_3$	
456	NH	-	"	
457	O	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{COCH}_3$	

Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
458	NH	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{COCH}_3$	
459	O	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{COC}_6\text{H}_5$	
460	NH	-	"	
461	O	-	$\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	
462	NH	-	"	
463	O	-	$\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	
464	NH	-	"	
465	O	-	$\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	
466	NH	-	"	
467	O	-	$\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	
468	NH	-	"	
469	O	-	OH	
470	NH	-	"	
471	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)_3$	
472	NH	-	"	
473	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{n}-\text{C}_8\text{H}_{17}$	
474	N	-	"	
475	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}_6\text{H}_5$	
476	NH	-	"	
477	O	-	N-(4-tert. Butylphenyl)-N-methyl-amino	
478	NH	-	"	

Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
479	O	-	2-(1,2,3,4-Tetrahydroiso- chinolin)-yl	
480	NH	-	"	
481	O	-	4-Phenylpiperidino	
482	NH	-	"	
483	O	-	4-Benzylpiperidino	
484	NH	-	"	

81

Tabelle 6



Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
521	O	-	H	
522	NH	-	H	
523	O	-	CH <sub>3</sub>	
524	NH	-	CH <sub>3</sub>	
525	O	-	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
526	NH	-	"	
527	O	-	nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	
528	NH	-	"	
529	O	-	Phenyl	
530	NH	-	"	
531	O	-	4-tert. Butylphenyl	
532	NH	-	"	
533	O	-	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
534	NH	-	"	
535	O	-	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	
536	NH	"	"	

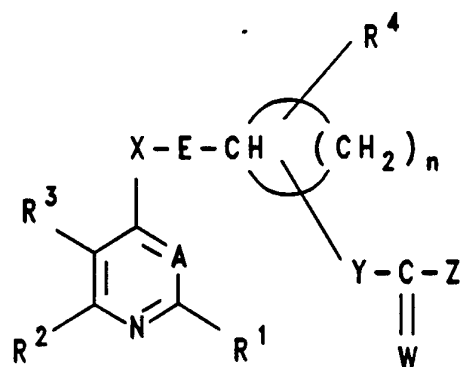
Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
537	O	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
538	NH		"	
539	O		-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	
540	NH		"	
541	O		-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Cyclohexyl	
542	NH		"	
543	O		OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Cyclopropyl	
544	NH		"	
545	O	-	1-Methylcyclohexyloxy	
546	NH	-	"	
547	O	-	1-Methylcyclopentyloxy	
548	NH	-	"	
549	O	-	1-Methylcyclobutyloxy	
550	NH	-	"	
551	O	-	2-(1,2,3,4-Tetrahydro- naphthalin)-yloxy	
552	NH	-	"	
553	O	-	-O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
554	NH	-	"	
555	O	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>	
556	NH	-	"	
557	O	-	-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	

Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
558	NH	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{COCH}_3$	
559	O	-	$-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{COC}_6\text{H}_5$	
560	NH	-	"	
561	O	-	$\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	
562	NH	-	"	
563	O	-	$\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	
564	NH	-	"	
565	O	-	$\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	
566	NH	-	"	
567	O	-	$\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	
568	NH	-	"	
569	O	-	OH	
570	NH	-	"	
571	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)_3$	
572	NH	-	"	
573	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)_n-\text{C}_8\text{H}_{17}$	
574	N	-	"	
575	O	-	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}_6\text{H}_5$	
576	NH	-	"	
577	O	-	N-(4-tert. Butylphenyl)-N-methyl-amino	
578	NH	-	"	

Bsp.-Nr.	X	Y	Z	Fp. [°C]
579	O	-	2-(1,2,3,4-Tetrahydroiso- chinolin)-yl	
580	NH	-	"	
581	O	-	4-Phenylpiperidino	
582	NH	-	"	
583	O	-	4-Benzylpiperidino	
584	NH	-	"	

## PATENTANSPRÜCHE

## 1. Verbindung der Formel I,



(I)

in welcher

R<sup>1</sup> Wasserstoff, Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl oder (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-Cycloalkyl bedeutet;  
 R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> gleich oder verschieden sind und jeweils Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkinyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-halogenalkyl, Halogen, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkanoyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkanoyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkanoyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-Halogencycloalkyl, Cyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Cyanalkyl, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Nitroalkyl, Thiocyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-carbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy-carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkylsulfonyl bedeutet;

oder

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen ungesättigten 5- oder 6-gliedrigen isocyclischen Ring bilden, der, falls es sich um einen 5-Ring handelt, an Stelle von CH<sub>2</sub> ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann oder der, falls es sich um einen 6-Ring handelt, an Stelle von einer oder zwei CH-Einheiten ein oder zwei

Stickstoffatome enthalten kann und der gegebenenfalls durch 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Reste substituiert ist und diese Reste (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkoxy bedeuten; oder

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gesättigten 5-, 6- oder 7-gliedrigen isocyclischen Ring bilden, der an Stelle von einer oder zwei CH<sub>2</sub>-Gruppen Sauerstoff und/oder Schwefel enthalten kann und der gegebenenfalls durch 1, 2 oder 3 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylgruppen substituiert ist;

A CH oder N bedeutet;

X NH, Sauerstoff oder Schwefel bedeutet;

E für eine direkte Bindung oder eine geradkettige oder verzweigte (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkandiyldgruppe, vorzugsweise für eine direkte Bindung steht;

n eine ganze Zahl von 2 bis 7 ist;

R<sup>4</sup> Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl bedeutet;

Y Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;

W Sauerstoff oder Schwefel bedeutet;

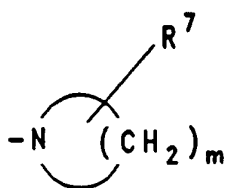
Z einen Rest DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet;

D Sauerstoff, Schwefel oder eine direkte Bindung bedeutet;

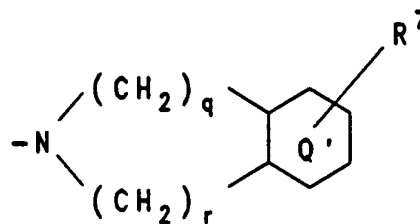
R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Aryl oder Heterocyclyl bedeutet, wobei die aufgeführten Aryl- oder Heterocyclyl-Reste unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen der verschiedenen Resten versehen sein können und in den genannten Alkyl, Alkenyl- oder Alkynyl-Resten eine oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei nicht benachbarte gesättigte Kohlenstoff-Einheiten durch eine Carbonyl-Gruppe oder durch Heteroatom-Einheiten, wie Sauerstoff, S(O)<sub>x</sub>, mit x = 0, 1 oder 2, NR<sup>9</sup> oder SiR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> ersetzt sein können, wobei R<sup>9</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkanoyl bedeutet und R<sup>7</sup> und R<sup>8</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, bevorzugt Methyl, bedeuten;

und worin darüber hinaus 3 bis 12 Atome dieser gegebenenfalls wie vorstehend modifizierten Kohlenwasserstoff-Reste einen Cyclus bilden

können und diese Kohlenwasserstoff-Reste mit oder ohne die angegebenen Variationen, gegebenenfalls mit einem oder mehreren, vorzugsweise bis zu drei, im Falle von Fluor bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Resten aus der Reihe Halogen, Aryl, Aryloxy, Arylthio, Cycloalkoxy, Cycloalkylthio, Heterocyclyl, Heterocyclioxy, Heterocyclylthio, Alkanoyl, Cycloalkanoyl, Halogenalkanoyl, Aroyl, Arylalkanoyl, Cycloalkylalkanoyl, Heterocyclylalkanoyl, Alkoxycarbonyl, Halogenalkoxycarbonyl, Cycloalkoxycarbonyl, Cycloalkylalkoxycarbonyl, Arylalkoxycarbonyl, Heterocyclylalkoxycarbonyl, Aryloxycarbonyl, Heterocyclioxycarbonyl, Alkanoyloxy, Halogenalkanoyloxy, Cycloalkanoyloxy, Cycloalkylalkanoyloxy, Aroyloxy, Arylalkanoyloxy, Heterocyclylalkanoyloxy, Alkylsulfonyloxy, Arylsulfonyloxy, Hydroxy, Cyano, Thiocyano oder Nitro substituiert sein können, wobei die cycloaliphatischen, aromatischen oder heterocyclischen Ringsysteme unter den soeben genannten Substituenten unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Substituenten versehen sein können, mit der Maßgabe, daß wenn der Heterocyclus in Formel I das Pyridin-System bedeutet ( $A = CH$ ,  $R^2$  und  $R^3$  nicht cyclisch verknüpft) und Z den Rest  $DR^5$  bedeutet,  $R^5$  nicht  $(C_1-C_4)$ -Alkyl bedeutet,  $R^5$  und  $R^6$  ein Ringsystem der Formel II oder III bilden



II



III

worin

der Sechsering  $Q'$  gesättigt oder aromatisch ist;

$m$  eine ganze Zahl von 2 bis 7 ist;

$q$  und  $r$  null oder ganze Zahlen sind, deren Summe eine Zahl von 2 bis 4 ergibt und worin gegebenenfalls eine  $CH_2$ -Einheit durch

Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppierung  $NR^{10}$  ersetzt ist und  $R^7$  und  $R^{10}$  gleich oder verschieden sind und jeweils Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio, Phenylalkyl oder Phenyl bedeuten und die Phenylgruppen unsubstituiert sind oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Substituenten versehen sein können oder deren Salze.

2. Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1,

in welcher

$R^5$  und  $R^6$  Wasserstoff,  $(C_1-C_{20})$ -Alkyl,  $(C_2-C_{20})$ -Alkenyl,  $(C_2-C_{20})$ -Alkynyl, Aryl, Heterocyclyl, sowie für den Fall, daß U eine direkte Bindung darstellt, darüber hinaus Hydroxy, Cyano, Thiocyano, Nitro oder Halogen bedeutet, wobei die aufgeführten Aryl- oder Heterocyclyl-Reste unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Resten versehen sein können und in den genannten Alkyl-, Alkenyl- oder Alkynyl-Resten eine oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei nicht benachbarte gesättigte Kohlenstoff-Einheiten durch eine Carbonyl-Gruppe oder durch Heteroatom-Einheiten, wie Sauerstoff,  $S(O)_x$ , mit  $x$  0, 1 oder 2,  $NR^9$  oder  $SiR^7R^8$  ersetzt sein können, wobei  $R^9$  Wasserstoff,  $(C_1-C_4)$ -Alkyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy oder  $(C_1-C_4)$ -Alkanoyl bedeutet und  $R^7$  und  $R^8$   $(C_1-C_4)$ -Alkyl, bevorzugt Methyl, bedeutet, und worin darüber hinaus 3 bis 12 Atome dieser gegebenenfalls wie vorstehend modifizierten Kohlenwasserstoff-Reste einen Cyclus bilden können und diese Kohlenwasserstoff-Reste mit oder ohne die angegebenen Variationen, gegebenenfalls mit einem oder mehreren, vorzugsweise bis zu drei, im Falle von Halogen bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Resten aus der Reihe Halogen, Aryl, Aryloxy, Arylthio,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylthio, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio,  $(C_1-C_{20})$ -Alkanoyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkanoyl,  $(C_1-C_{20})$ -Halogenalkanoyl, Aroyl, Aryl- $(C_1-C_4)$ -alkanoyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -alkanoyl, Heterocyclyl- $(C_1-C_4)$ -

alkanoyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkoxy-carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)-Halogenalkoxy-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxy-carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy-carbonyl-, Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy-carbonyl, Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy-carbonyl, Aryloxy-carbonyl, Heterocycliloxy-carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkanoyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-Halogenalkanoylalkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkanoyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkanoyloxy, Aroyloxy, Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkanoyloxy, Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkanoyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkylsulfonyloxy, Arylsulfonyloxy, Hydroxy, Cyano, Thiocyano oder Nitro substituiert sein können, wobei die cycloaliphatischen, aromatischen oder heterocyclischen Ringsysteme unter den soeben genannten Substituenten unsubstituiert oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Substituenten versehen sein können, oder R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> ein Ringsystem der Formel II oder III bilden

worin

der Sechsring Q' gesättigt oder aromatisch ist;

m eine ganze Zahl von 2 bis 7 ist;

q und r ganze Zahlen sind, deren Summe eine Zahl von 2 bis 4 ergibt und worin gegebenenfalls eine CH<sub>2</sub>-Einheit durch Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppierung NR<sup>10</sup> ersetzt sein kann und

R<sup>7</sup> und R<sup>10</sup> gleich oder verschieden sind und jeweils Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio, Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl oder mit bis zu drei, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl an gleichen oder verschiedenen Substituenten versehen sein können

oder deren Salze.

3. Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2,

in welcher

R<sup>1</sup> Wasserstoff bedeutet;

- $R^2$  (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, Cyclopropyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Halogenalkyl oder Methoxymethyl bedeutet;
- $R^3$  Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Halogen oder Cyano bedeutet; oder
- $R^2$  und  $R^3$  zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind einen ungesättigten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der im Falle des 5-Rings an Stelle einer CH<sub>2</sub>-Einheit ein Schwefelatom enthalten kann oder  $R^2$  und  $R^3$  zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gesättigten 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der an Stelle einer CH<sub>2</sub>-Einheit ein Schwefel- oder ein Sauerstoffatom enthalten kann;
- A CH oder N bedeutet;
- X NH oder Sauerstoff bedeutet;
- E für eine direkte Bindung steht;
- $R^4$  Wasserstoff oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl bedeutet;
- Y Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;
- W Sauerstoff bedeutet;
- Z einen Rest DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet; und
- D Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;
- oder deren Salze.

4. Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in welcher

- $R^2$  (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkyl, Cyclopropyl, Trifluormethyl oder Methoxymethyl bedeutet;
- $R^3$  Methyl, Ethyl, Methoxy, Halogen oder Cyano bedeutet; oder
- $R^2$  und  $R^3$  zusammen mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, das Chinazolin- oder Chinolin-System bilden; oder
- $R^2$  und  $R^3$  zusammen mit den Kohlenstoffatomen an die sie gebunden sind, einen gesättigten 6-gliedrigen Ring bilden, der ein Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und
- Z einen Rest DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet;
- oder deren Salze.

5. Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4,  
in welcher
- R<sup>1</sup> Wasserstoff bedeutet;
  - R<sup>2</sup> Ethyl, Propyl, Isopropyl oder Methoxymethyl bedeutet;
  - R<sup>3</sup> Fluor, Chlor, Brom oder Methoxy bedeutet;
- oder,
- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, das Chinazolin-System bilden, das mit Fluor, Chlor, Brom und/oder Methyl substituiert sein kann; oder
- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit dem Pyrimidin-Ring das 5,6,7,8-Tetrahydrochinazolin-System bilden
- A CH oder N bedeutet;
  - X NH bedeutet;
  - E für eine direkte Bindung steht;
  - R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet;
  - n die Zahlen 4 oder 5 bedeutet;
  - Y Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;
  - Z DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet;
  - D Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet und
  - W Sauerstoff bedeutet;
- oder deren Salze.
6. Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5,  
in welcher
- R<sup>1</sup> Wasserstoff bedeutet;
  - R<sup>2</sup> Methoxymethyl und R<sup>3</sup> Methoxy oder Chlor bedeutet; oder
  - R<sup>2</sup> Ethyl, Propyl, Isopropyl und R<sup>3</sup> Chlor oder Brom bedeutet;
- oder
- R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, das Chinazolin-System bilden;
- A CH oder N bedeutet;
  - X NH bedeutet;

E für eine direkte Bindung steht;  
R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet;  
n die Zahl 4 oder 5 bedeutet;  
Y eine direkte Bindung bedeutet;  
Z DR<sup>5</sup> oder NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet;  
D Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet und  
W Sauerstoff bedeutet;  
oder deren Salze.

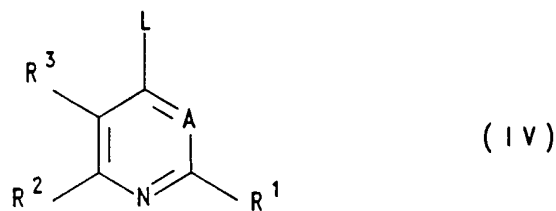
7. Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6,  
in welcher

R<sup>1</sup> Wasserstoff bedeutet;  
R<sup>2</sup> Methoxymethyl und R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten;  
oder  
R<sup>2</sup> Ethyl und R<sup>3</sup> Chlor oder Brom bedeutet; oder  
R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen mit den Kohlenstoffatomen an die sie gebunden sind, das  
Chinazolin-System bilden;  
A Stickstoff bedeutet;  
X NH bedeutet;  
E für eine direkte Bindung steht;  
R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet;  
n die Zahl 5 bedeutet und die Reste in der 1,4-Position stehen und cis-  
ständig zueinander sind;  
Y eine direkte Bindung bedeutet;  
W Sauerstoff bedeutet;  
Z DR<sup>5</sup> bedeutet;  
D Sauerstoff oder eine direkte Bindung bedeutet;  
oder deren Salze.

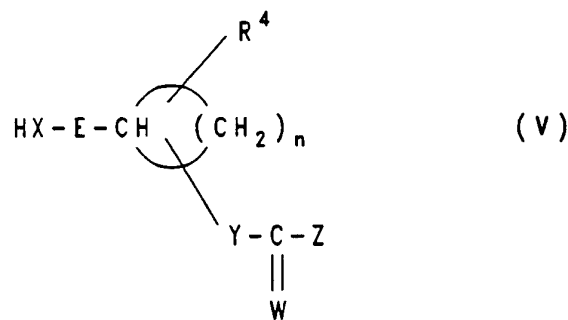
8. Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7, in welcher  $n = 5$  ist, -Y-CW-Z bezüglich -X-E- in 4-Position des Cyclohexan-Rings steht und diese beiden Gruppen sich in cis-Konfiguration zueinander befinden, oder deren Salze.

9. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, daß man

a) eine Verbindung der Formel IV,

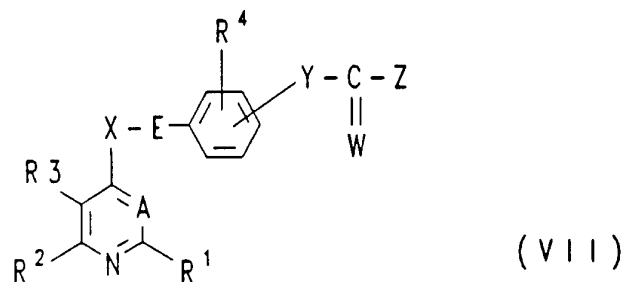


in welcher A,  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  wie in Formel I definiert sind und L eine Abgangsgruppe bedeutet, umgesetzt mit einer Verbindung der Formel V



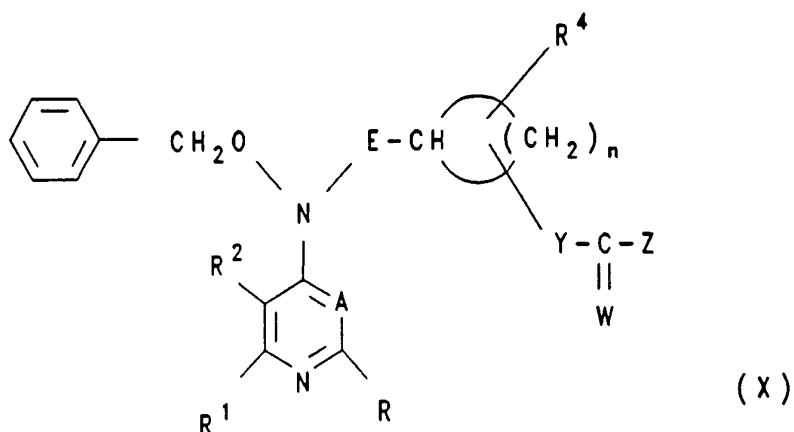
in welcher X, E,  $R^4$ , n, Y, W und Z wie in Formel I definiert sind,

b) zur Herstellung einer Verbindung der Formel I, worin  $n = 5$  ist, eine Verbindung der Formel VII



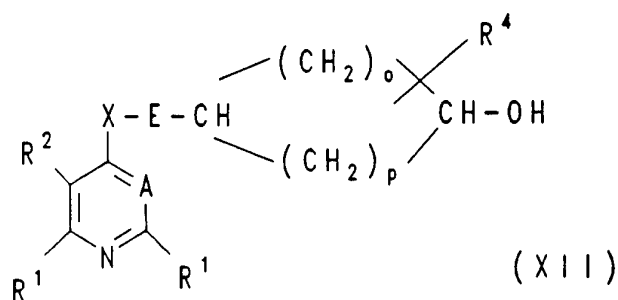
in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X, E, R<sup>4</sup>, Y, W und Z wie in Formel I definiert sind, hydriert,

- c) zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin X NH bedeutet, eine Verbindung der Formel X



in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, E, n, R<sup>4</sup>, Y, W und Z wie in Formel I definiert sind, reduziert;

- d) zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- bedeuten, ein Chinolin der Formel I, worin R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen -CH=CH-CH=CH- bedeutet, wobei die übrigen Reste wie oben in Formel I definiert sind, in Gegenwart eines Edelmetallkatalysators hydriert,
- e) zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin Y Sauerstoff bedeutet, eine Verbindung der Formel XII



in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X, E und R<sup>4</sup> wie in Formel I definiert sind, mit einer Verbindung der Formel L-C-Z, in welcher



W und Z wie in Formel I und L wie in Formel IV definiert sind, acyliert;

- f) in den nach a) bis e) erhaltenen Verbindungen gegebenenfalls die Gruppierung -Y-C-Z gegebenenfalls in an sich bekannter Weise weiter
- $$\begin{array}{c} \parallel \\ W \end{array}$$
- abwandelt,

- g) in den nach a) bis f) erhaltenen Verbindungen, einen Rest R<sup>3</sup> = Wasserstoff gegebenenfalls gegen Halogen austauscht; und die so erhaltenen Verbindungen der Formel I gegebenenfalls in ihr Salz überführt.

10. Mittel enthaltend mindestens eine Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 und mindestens ein Formulierungsmittel.

11. Fungizides Mittel gemäß Anspruch 10, enthaltend eine fungizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zusammen mit den für diese Anwendung üblichen Zusatz- oder Hilfsstoffen.

12. Insektizides, akarizides, ixodizides oder nematizides Mittel gemäß Anspruch 10, enthaltend eine wirksame Menge mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zusammen mit den für diese Anwendung üblichen Zusatz- oder Hilfsstoffen.

13. Pflanzenschutzmittel, enthaltend eine fungizid, insektizid, akarizid, ixodizid oder nematizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 und mindestens einem weiteren Wirkstoff, vorzugsweise aus der Reihe der Fungizide, Insektizide, Lockstoffe, Sterilantien, Akarizide,

Nematizide und Herbizide zusammen mit den für diese Anwendung üblichen Hilfs- und Zusatzstoffen.

14. Mittel zur Anwendung im Holzschutz oder als Konservierungsmittel in Dichtmassen, in Anstrichfarben, in Kühlschmiermitteln für die Metallbearbeitung oder in Bohr- und Schneidölen, enthaltend eine wirksame Menge mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zusammen mit den für diese Anwendungen üblichen Hilfs- und Zusatzstoffen.

15. Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 oder Mittel gemäß Anspruch 10, zur Anwendung als Tierarzneimittel, vorzugsweise bei der Bekämpfung von Endo- oder Ektoparasiten.

16. Verfahren zur Herstellung eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 10 bis 15, dadurch gekennzeichnet, daß man den Wirkstoff und die weiteren Zusätze zusammen gibt und in eine geeignete Anwendungsform bringt.

17. Verwendung einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 oder Mittels gemäß einem der Ansprüche 10, 11, 13 und 14 als Fungizid.

18. Verwendung einer Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 oder eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 10, 11 und 14 als Holzschutzmittel oder als Konservierungsmittel in Dichtmitteln, in Anstrichfarben, in Kühlschmiermitteln für die Metallbearbeitung oder in Bohr- und Schneidölen.

19. Verfahren zur Bekämpfung von phytopathogenen Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die von ihnen befallenen Pflanzen, Flächen oder Substrate oder auf Saatgut eine fungizid wirksame Menge einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 oder eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 10, 11, 13 und 14 appliziert.

20. Verfahren zur Bekämpfung von Schadinsekten, Acarina, Mollusken und Nematoden, bei welchem man auf diese oder die von ihnen befallenen Pflanzen, Flächen oder Substrate eine wirksame Menge einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 oder eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 10, 11 und 13 appliziert.

21. Verwendung von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 oder eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 10, 11 und 13 zur Bekämpfung von Schadinsekten, Acarina, Mollusken und Nematoden.

22. Saatgut, behandelt oder beschichtet mit einer wirksamen Menge einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 oder eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 10, 11, 13 und 14.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Intern. Application No  
**PCT/EP 95/01666**

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
**IPC 6 C07D239/42 C07D239/52 A01N43/54**

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
**IPC 6 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)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO,A,93 19050 (HOECHST) 30 September 1993 see page 1 - page 63; claims; examples 228,1334; table 1 -----	1,9-22

Further documents are listed in the continuation of box C.       Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

<p>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>"E" earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>"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)</p> <p>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p>	<p>"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</p> <p>"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</p> <p>"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.</p> <p>"&amp;" document member of the same patent family</p>
--	--

Date of the actual completion of the international search <b>22 August 1995</b>	Date of mailing of the international search report <b>28. 08. 95</b>
--	---

Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. ( + 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: ( + 31-70) 340-3016	Authorized officer <b>Francois, J</b>
--	--

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Interr. Application No  
**PCT/EP 95/01666**

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO-A-9319050	30-09-93	DE-A- 4208254	16-09-93
		AU-B- 3746693	21-10-93
		CA-A- 2131545	30-09-93
		CN-A- 1076692	29-09-93
		EP-A- 0631575	04-01-95
		HU-A- 67295	28-03-95
		JP-T- 7506347	13-07-95
		ZA-A- 9301774	30-09-93
-----			

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internes Aktenzeichen

PCT/EP 95/01666

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b> IPK 6 C07D239/42 C07D239/52 A01N43/54		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b>		
Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 6 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)		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO,A,93 19050 (HOECHST) 30. September 1993 siehe Seite 1 - Seite 63; Ansprüche; Beispiele 228,1334; Tabelle 1 -----	1,9-22
<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen		
<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :		
"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist		
"B" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		
"I" 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 erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden		
"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist		
"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche  22. August 1995		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts  28. 08. 95
Name und Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. ( + 31-70) 340-2040, Tlx. 31 651 epo nl, Fax: ( + 31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter  Francois, J

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Intern: Jes Aktenzeichen

PCT/EP 95/01666

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO-A-9319050	30-09-93	DE-A- 4208254	16-09-93
		AU-B- 3746693	21-10-93
		CA-A- 2131545	30-09-93
		CN-A- 1076692	29-09-93
		EP-A- 0631575	04-01-95
		HU-A- 67295	28-03-95
		JP-T- 7506347	13-07-95
		ZA-A- 9301774	30-09-93
-----			