

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
11. Januar 2007 (11.01.2007)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2007/003295 A3

(51) Internationale Patentklassifikation:  
C07D 261/00 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2006/006123

(22) Internationales Anmeldedatum:  
24. Juni 2006 (24.06.2006)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
10 2005 031 583.6 6. Juli 2005 (06.07.2005) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHAPER, Wolfgang [DE/DE]; Kapellenweg 5c, 86420 Diedorf (DE). HELMKE, Hendrik [DE/DE]; Im Kohlruss 51, 65835 Liederbach (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,

AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

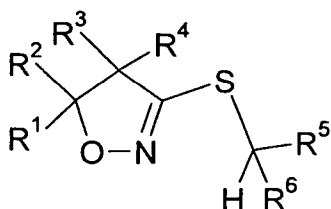
— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 19. Juli 2007

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

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING 3-ARYLMETHYLTHIO- AND 3-HETEROARYLMETHYLTHIO-4,5-DIHYDRO-ISOXAZOLINE DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 3-ARYLMETHYLTHIO- UND 3-HETEROARYLMETHYLTHIO-4,5-DIHYDRO-ISOXAZOLIN-DERIVATEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to a method for producing 3-arylmethylthio- and 3-heteroarylmethylthio-4,5-dihydro-isoxazoline derivatives of general formula (I), by means of a one-pot reaction wherein corresponding arylmethyl and heteroarylmethyl-isothiuronium salts are reacted in the presence of an aqueous alkali or earth alkali base with an isoxazoline derivative in order to form the corresponding 3-arylmethylthio- and 3-heteroarylmethylthio-4,5-dihydro-isoxazoline derivatives.

(57) Zusammenfassung: Verfahren zur Herstellung von 3-Arylmethylthio- und 3-Heteroarylmethylthio-4,5-dihydro-isoxazolin-Derivaten Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von von 3-Arylmethylthio- und 3-Heteroarylmethylthio-4,5-dihydro-isoxazolin-Derivaten der allgemeinen Formel (I) durch ein Eintopfverfahren, in dem korrespondierende Arylmethyl- und Heteroarylmethyl-isothiuroniumsalze in Gegenwart einer wässrigen Alkali- oder Erdalkalibase mit einem Isoxazolin-Derivat zu den entsprechenden 3-Arylmethylthio- und 3-Heteroarylmethylthio-4,5-dihydro-isoxazolin-Derivaten umgesetzt werden.

WO 2007/003295 A3

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/EP2006/006123

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
INV. C07D261/00

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

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
C07D

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

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

EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2004/013106 A (IHARA CHEMICAL IND CO [JP]; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO [JP]; NAKATANI) 12 February 2004 (2004-02-12) example 1 - & EP 1 541 561 A (IHARA CHEMICAL IND CO [JP]; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO [JP]) 15 June 2005 (2005-06-15) page 32, line 51 - page 33, line 1; example 1 -----	1-18

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

\* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \* & \* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

11 April 2007

Date of mailing of the international search report

19/04/2007

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  
  
van Laren, Martijn

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No PCT/EP2006/006123
---

Patent document cited in search report	A	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
WO 2004013106	A	12-02-2004		AU 2003252447 A1	23-02-2004
				BR 0313178 A	14-06-2005
				CA 2494130 A1	12-02-2004
				CN 1678588 A	05-10-2005
				EP 1541561 A1	15-06-2005
				KR 20050026082 A	14-03-2005
				MX PA05001258 A	28-04-2005
				US 2005215797 A1	29-09-2005
<hr style="border-top: 1px dashed black;"/>					
EP 1541561	A	15-06-2005		AU 2003252447 A1	23-02-2004
				BR 0313178 A	14-06-2005
				CA 2494130 A1	12-02-2004
				CN 1678588 A	05-10-2005
				WO 2004013106 A1	12-02-2004
				KR 20050026082 A	14-03-2005
				MX PA05001258 A	28-04-2005
				US 2005215797 A1	29-09-2005
<hr style="border-top: 1px dashed black;"/>					

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2006/006123

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b> INV. C07D261/00		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b>		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole ) C07D		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 2004/013106 A (IHARA CHEMICAL IND CO [JP]; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO [JP]; NAKATANI) 12. Februar 2004 (2004-02-12) Beispiel 1 -& EP 1 541 561 A (IHARA CHEMICAL IND CO [JP]; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO [JP]) 15. Juni 2005 (2005-06-15) Seite 32, Zeile 51 - Seite 33, Zeile 1; Beispiel 1 -----	1-18
<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 *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
11. April 2007		19/04/2007
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter  van Laren, Martijn

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2006/006123

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2004013106 A	12-02-2004	AU 2003252447 A1	23-02-2004
		BR 0313178 A	14-06-2005
		CA 2494130 A1	12-02-2004
		CN 1678588 A	05-10-2005
		EP 1541561 A1	15-06-2005
		KR 20050026082 A	14-03-2005
		MX PA05001258 A	28-04-2005
		US 2005215797 A1	29-09-2005
EP 1541561 A	15-06-2005	AU 2003252447 A1	23-02-2004
		BR 0313178 A	14-06-2005
		CA 2494130 A1	12-02-2004
		CN 1678588 A	05-10-2005
		WO 2004013106 A1	12-02-2004
		KR 20050026082 A	14-03-2005
		MX PA05001258 A	28-04-2005
		US 2005215797 A1	29-09-2005