

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro



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

(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ :

C07D 209/96, A01N 43/08, 43/10, 43/12,
43/36, 43/42, C07D 207/40, 491/10,
309/28, 307/24, 307/94, 333/50, C07C
49/733, 49/88, 49/747

A1

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 99/48869

not sl

(43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

30. September 1999 (30.09.99)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/01787

(22) Internationales Anmeldedatum: 18. März 1999 (18.03.99)

(30) Prioritätsdaten:

198 13 354.5

26. März 1998 (26.03.98)

DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen
(DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): LIEB, Folker [DE/DE];
Alfred-Kubin-Strasse 1, D-51375 Leverkusen (DE).
FISCHER, Reiner [DE/DE]; Nelly-Sachs-Strasse 23,
D-40789 Monheim (DE). GRAFF, Alan [DE/DE]; Ger-
stenkamp 19, D-51061 Köln (DE). SCHNEIDER, Udo
[DE/DE]; Moltkestrasse 12, D-51373 Leverkusen (DE).
BRETSCHNEIDER, Thomas [DE/DE]; Talstrasse 29 b,
D-53797 Lohmar (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE];
Unterbüschhof 15, D-42799 Leichlingen (DE). ANDER-
SCH, Wolfram [DE/DE]; Schlodderdicherweg 77, D-51469
Bergisch Gladbach (DE). DREWES, Mark, Wilhelm
[DE/DE]; Goethestrasse 38, D-40764 Langenfeld (DE).

DOLLINGER, Markus [DE/US]; 13210 Knox, Overland
Park, KS 66213 (US). WETCHOLOWSKY, Ingo [DE/BR];
Cond. Estancia Marambaia, Rua Avare 500, CEP-13 280
000 Vinhedo, SP (BR). MYERS, Randy, Allen [US/DE];
Heltorfer Mark 47, D-40489 Düsseldorf (DE).

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

(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG,
MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE,
SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN,
YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD,
SL, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG,
KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH,
CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

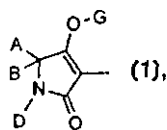
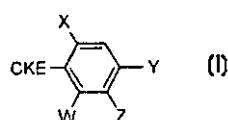
Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen
eintreffen.

(54) Title: ARYL PHENYL SUBSTITUTED CYCLIC KETOENOLS

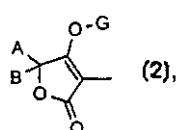
(54) Bezeichnung: ARYLPHENYLSUBSTITUIERTE CYCLISCHE KETOENOLE

(57) Abstract

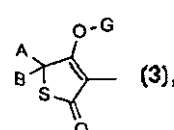
The invention relates
to new aryl phenyl substituted
ketoenols of formula
(I), where X is halogen,
alkyl, alkoxy, alkenyloxy,
alkylthio, alkyl sulfinyl,
alkyl sulfonyl, halogen alkyl,
halogen alkoxy, halogen
alkenyloxy, nitro, cyano or
possibly substituted phenyl,
phenoxy, phenylthio, phenyl
alkoxy or phenyl alkylthio;
Z is possibly substituted
cycloalkyl, aryl or hetaryl; W
and Z independently of each
other are hydrogen, halogen,
alkyl, alkoxy, alkenyloxy,
halogen alkyl, halogen
alkoxy, halogen alkenyloxy,
nitro or cyano; and CKE is
one of groups (1), (2), (3),
(4), (5), (6), (7) or (8), where



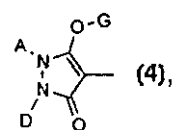
(1),



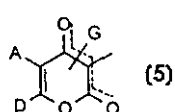
(2),



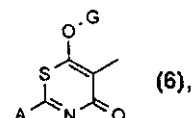
(3),



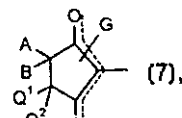
(4),



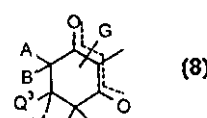
(5),



(6),



(7),



(8)

A, B, D, G and Q¹ to Q⁶ have the meanings assigned in the description. The invention also relates to several methods for producing said
ketoenols and to their use as pest control agents and herbicides.

(57) Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung betrifft neue arylphenylsubstituierte cyclische Ketoenole der Formel (I), in welcher X für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Nitro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylalkoxy oder Phenylalkylthio steht, Z für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Aryl oder Hetaryl steht, W und Z unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Nitro oder Cyano steht, CKE für eine der Gruppen (1), (2), (3), (4), (5), (6), (7) oder (8) steht, worin A, B, D, G und Q¹ bis Q⁶ die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel und Herbizide.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

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

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidshan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						

Arylphenylsubstituierte cyclische Ketoenole

Die vorliegende Erfindung betrifft neue arylphenylsubstituierte cyclische Ketoenole,
5 mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel und Herbizide.

Von 3-Acyl-pyrrolidin-2,4-dionen sind pharmazeutische Eigenschaften vorbeschrieben (S. Suzuki et al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)). Weiterhin wurden
10 N-Phenylpyrrolidin-2,4-dione von R. Schmierer und H. Mildenberger (Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095) synthetisiert. Eine biologische Wirksamkeit dieser Verbindungen wurde nicht beschrieben.

In EP-A-0 262 399 und GB-A-2 266 888 werden ähnlich strukturierte Verbindungen
15 (3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dione) offenbart, von denen jedoch keine herbizide, insektizide oder akarizide Wirkung bekannt geworden ist. Bekannt mit herbizider, insektizider oder akarizider Wirkung sind unsubstituierte, bicyclische 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate (EP-A-355 599 und EP-415 211) sowie substituierte monocyclische 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate (EP-A-377 893 und EP-442 077).

20 Weiterhin bekannt sind polycyclische 3-Arylpyrrolidin-2,4-dion-Derivate (EP-442 073) sowie 1H-Arylpyrrolidin-dion-Derivate (EP-456 063, EP-521 334, EP-596 298, EP-613 884, EP-613 885, WO 94/01 997, WO 95/26 954, WO 95/20 572, EP-A-0 668 267, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243 und
25 WO 97/36 868, DE-19 716 591).

Es ist bekannt, daß bestimmte substituierte Δ^3 -Dihydrofuran-2-on-Derivate herbizide Eigenschaften besitzen (vgl. DE-A-4 014 420). Die Synthese der als Ausgangsverbindungen verwendeten Tetronsäurederivate (wie z.B. 3-(2-Methyl-phenyl)-4-hydroxy-5-(4-fluorphenyl)- Δ^3 -dihydrofuranon-(2)) ist ebenfalls in DE-A-4 014 420
30 beschrieben. Ähnlich strukturierte Verbindungen ohne Angabe einer insektiziden

und/oder akariziden Wirksamkeit sind aus der Publikation Campbell et al., J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1985, (8) 1567-76 bekannt. Weiterhin sind 3-Aryl- Δ^3 -dihydrofuranon-Derivate mit herbiziden, akariziden und insektiziden Eigenschaften aus EP-A-528 156, EP-A-0 647 637, WO 95/26 345, WO 96/20 196, WO 96/25 395, 5 WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243 und WO 97/36 868, DE 19 716 591 bekannt. Auch 3-Aryl- Δ^3 -dihydrothiphen-on-Derivate sind bekannt (WO 95/26 345, 96/25 395, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, DE 19 716 591).

Aus der Literatur sind ferner bestimmte 3H-Pyrazol-3-on-Derivate, wie beispielsweise 1,2-Diethyl-1,2-dihydro-5-hydroxy-4-phenyl-3H-pyrazol-3-on oder {[5-Oxo-1,2-diphenyl-4-(p-sulfophenyl)-3-pyrazolin-3-yl]-oxy}-dinatriumsalz oder p-(3-Hydroxy-5-oxo-1,2-diphenyl-3-pyrazolin-4-yl)-benzolsulfonsäure bekannt (vgl. J. Heterocycl. Chem., 25(5), 1301-1305, 1988 oder J. Heterocycl. Chem., 25(5), 1307-1310, 1988 oder Zh. Obshch. Khim., 34(7), 2397-2402, 1964). Eine biologische Wirkung 15 dieser Verbindungen wird aber nicht beschrieben.

Weiterhin ist bekannt, daß das Trinatriumsalz der 4,4',4''-(5-Hydroxy-3-oxo-1H-pyrazol-1,2,4(3H)-triyl)-tris-benzolsulfonsäure pharmakologische Eigenschaften besitzt (vgl. Farmakol. Toksikol. (Moscow), 38(2), 180-186, 1976). Seine Verwendung 20 im Pflanzenschutz ist aber nicht bekannt.

Außerdem sind in EP-508 126 und in WO 92/16 510, WO 96/21 652 4-Arylpyrazolidin-3,5-dion-Derivate mit herbiziden, akariziden und insektiziden Eigenschaften beschrieben. Zudem wurden 4-Arylpyrazolidine bekannt, von denen 25 fungizide Eigenschaften beschrieben wurden (WO 96/36 229, WO 96/36 615, WO 96/36 616, WO 96/36 633).

Bestimmte, im Phenylring unsubstituierte Phenyl-pyron-Derivate sind bereits bekannt geworden (vgl. A.M. Chirazi, T. Kappe und E. Ziegler, Arch. Pharm. 309, 558 (1976) und K.-H. Boltze und K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849), wobei für 30 diese Verbindungen eine mögliche Verwendbarkeit als Schädlingsbekämpfungsmittel

mittel nicht angegeben wird. Im Phenylring substituierte Phenyl-pyron-Derivate mit herbiziden, akariziden und insektiziden Eigenschaften sind in EP-A-588 137, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/16 436, WO 97/19 941 und WO 97/36 868, DE-19 716 591 beschrieben.

5

Bestimmte, im Phenylring unsubstituierte 5-Phenyl-1,3-thiazin-Derivate sind bereits bekannt geworden (vgl. E. Ziegler und E. Steiner, Monatsh. 95, 147 (1964), R. Ketcham, T. Kappe und E. Ziegler, J. Heterocycl. Chem. 10, 223 (1973)), wobei für diese Verbindungen eine mögliche Anwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel

10

nicht angegeben wird. Im Phenylring substituierte 5-Phenyl-1,3-thiazin-Derivate mit herbizider, akarizider und insektizider Wirkung sind in WO 94/14 785, WO 96/02 539, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/02 243, WO 97/36 868 beschrieben.

15

Es ist bekannt, daß bestimmte substituierte 2-Arylcyclopentandione herbizide und akarizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. US-4 283 348; 4 338 122; 4 436 666; 4 526 723; 4 551 547; 4 632 698; WO 96/01 798; WO 96/03 366 sowie WO 97/14 667). Außerdem sind ähnlich substituierte Verbindungen bekannt; 3-Hydroxy-5,5-dimethyl-2-phenylcyclopent-2-en-1-on aus der Publikation Micklefield et al., Tetrahedron, (1992), 7519-26 sowie der Naturstoff Involutin (-)-cis-5-(3,4-dihydroxyphenyl)-3,4-dihydroxy-2-(4-hydroxyphenyl)-cyclopent-2-en-one aus der Publikation Edwards et al., J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9. Eine insektizide oder akarizide Wirkung wird nicht beschrieben. Außerdem ist 2-(2,4,6-Trimethylphenyl)-1,3-indandion aus der Publikation J. Economic Entomology, 66, (1973), 584 und der Offenlegungsschrift DE-2 361 084 bekannt, mit Angabe von herbiziden und akariziden Wirkungen.

20

25

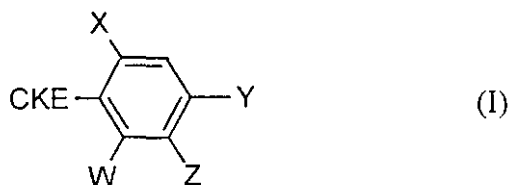
Es ist bekannt, daß bestimmte substituierte 2-Arylcyclohexandione herbizide und akarizide Eigenschaften besitzen (US-4 175 135, 4 209 432, 4 256 657, 4 256 658, 4 256 659, 4 257 858, 4 283 348, 4 303 669, 4 351 666, 4 409 153, 4 436 666,

30

4 526 723, 4 613 617, 4 659 372, DE-2 813 341, sowie Wheeler, T.N., J. Org. Chem. 44, 4906 (1979)).

Die Wirksamkeit und Wirkungsbreite dieser Verbindungen ist jedoch insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen und Konzentrationen nicht immer völlig zufriedenstellend. Weiterhin ist die Pflanzenverträglichkeit dieser Verbindungen nicht immer ausreichend.

Es wurden nun neue Verbindungen der Formel (I)



10

in welcher

X für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Nitro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylalkoxy oder Phenylalkylthio steht,

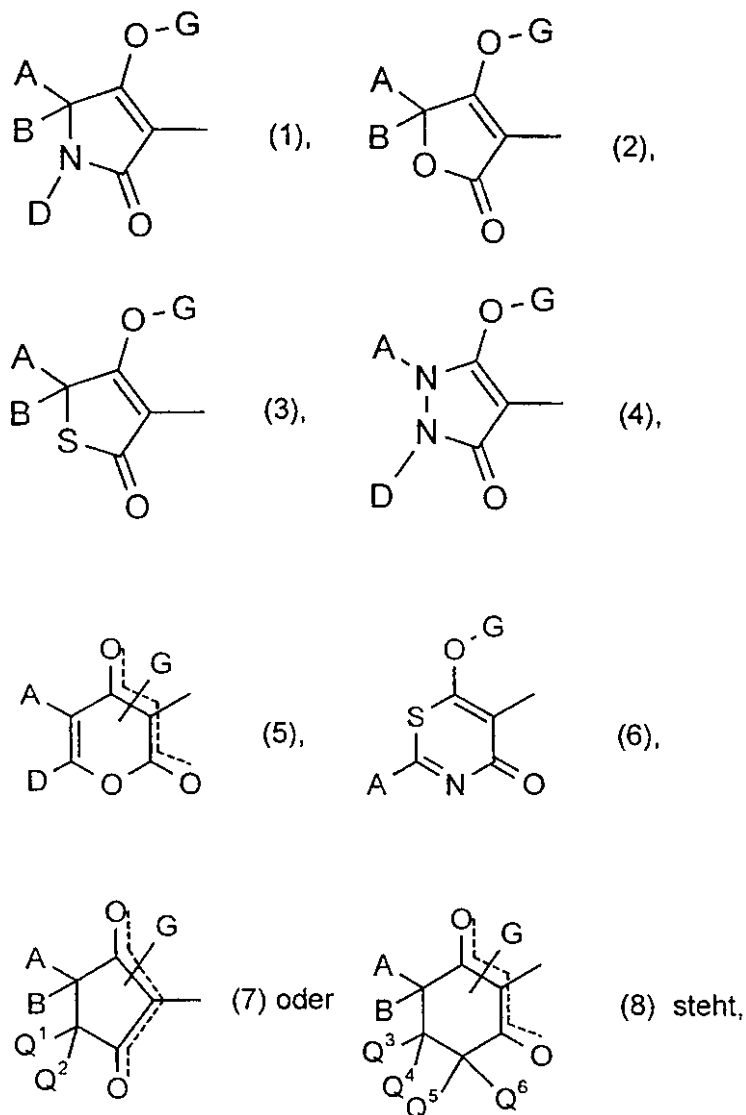
15

Z für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Aryl oder Hetaryl steht,

W und Y unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Nitro oder Cyano stehen,

20

CKE für eine der Gruppen



worin

5

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

10

B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, oder

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

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

15 A und D gemeinsam mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen gesättigten oder ungesättigten und gegebenenfalls mindestens ein (im Falle CKE = (4) weiteres) Heteroatom enthaltenden, im A,D-Teil unsubstituierten oder substituierten Ring stehen, bzw.

20 A und Q¹ gemeinsam für jeweils gegebenenfalls durch jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Hydroxy, Alkoxy, Alkylthio, Cycloalkyl, Benzyl-
oxy oder Aryl substituiertes Alkandiyl oder Alkendiyl stehen oder

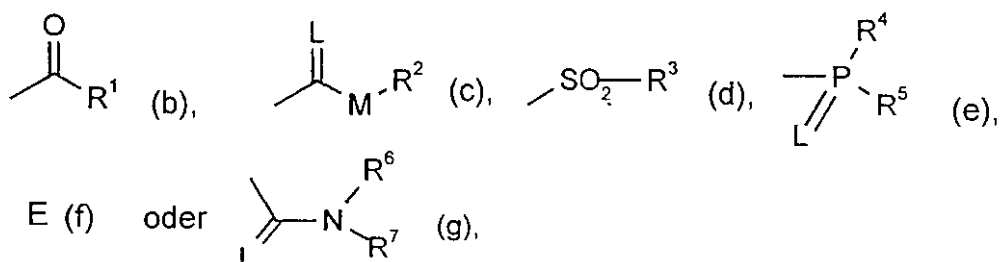
Q¹ für Wasserstoff oder Alkyl steht,

25 Q², Q⁴, Q⁵ und Q⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Alkyl stehen,

30 Q³ für Wasserstoff, Alkyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl (worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist) oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht, oder

Q³ und Q⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten, gegebenenfalls ein Heteroatom enthaltenden unsubstituierten oder substituierten Ring stehen,

5 G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



steht,

10 worin

E für ein Metallion oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht,

15

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

20

R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl oder Alkoxy substituiertes Cycloalkyl, das durch mindestens ein Heteroatom unterbrochen sein kann, jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenylalkyl, Hetaryl, Phenoxyalkyl oder Hetaryloxyalkyl steht,

25

5
10
15
20
25
30

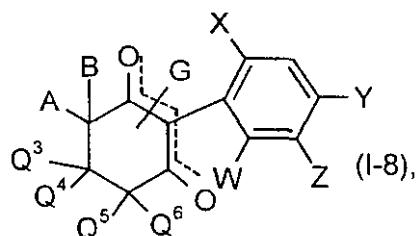
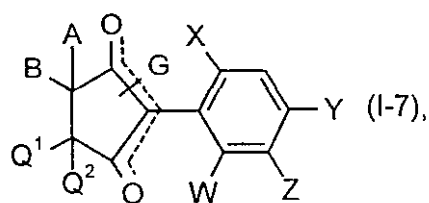
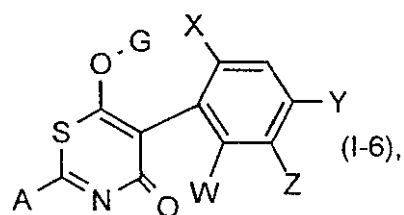
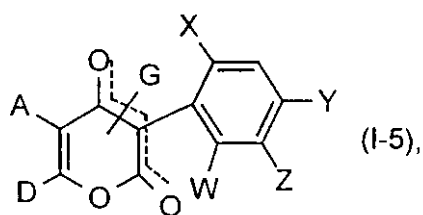
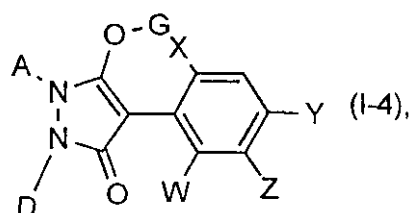
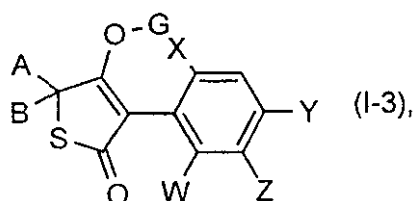
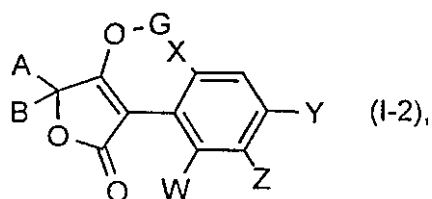
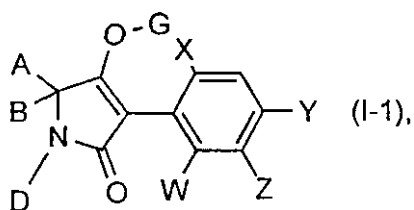
R^2 für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl steht,

R^3 , R^4 und R^5 unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylthio, Alkenylthio, Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenoxy oder Phenylthio stehen und

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

Die Verbindungen der Formel (I) können, auch in Abhängigkeit von der Art der Substituenten, als geometrische und/oder optische Isomere oder Isomerengemische, in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen, die gegebenenfalls in üblicher Art und Weise getrennt werden können. Sowohl die reinen Isomeren als auch die Isomerengemische, deren Herstellung und Verwendung sowie diese enthaltende Mittel sind Gegenstand der vorliegenden Erfindung. Im folgenden wird der Einfachheit halber jedoch stets von Verbindungen der Formel (I) gesprochen, obwohl sowohl die reinen Verbindungen als gegebenenfalls auch Gemische mit unterschiedlichen Anteilen an isomeren Verbindungen gemeint sind.

Unter Einbeziehung der Bedeutungen (1) bis (8) der Gruppe CKE ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-1) bis (I-8):

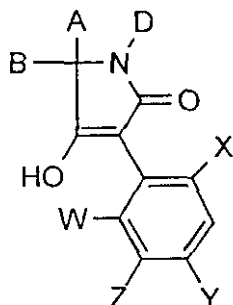


5 worin

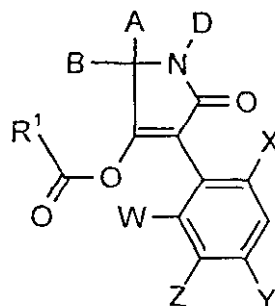
A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben.

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

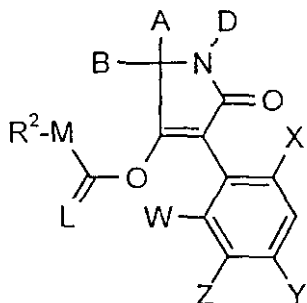
(I-1-a):



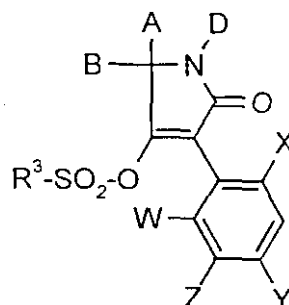
(I-1-b):



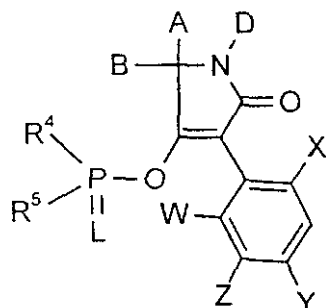
(I-1-c):



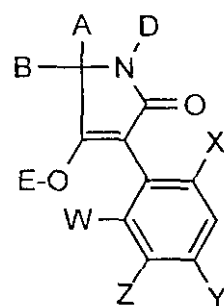
(I-1-d):



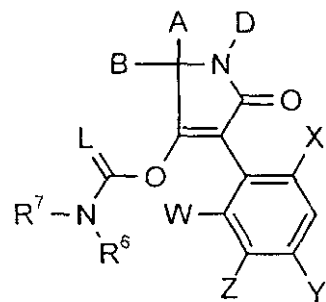
(I-1-e):



(I-1-f):



(I-1-g):

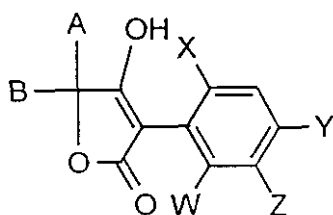


worin

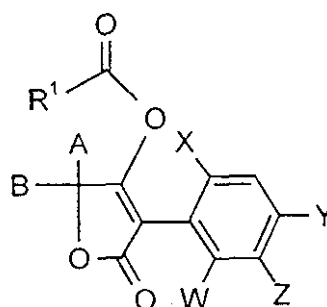
A, B, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen besitzen.

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

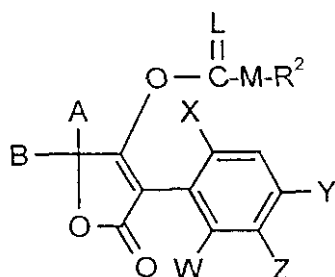
(I-2-a):



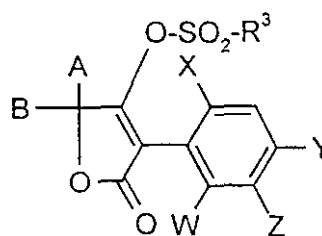
(I-2-b):



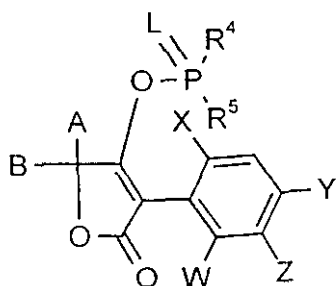
(I-2-c):



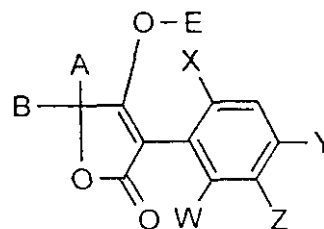
(I-2-d):



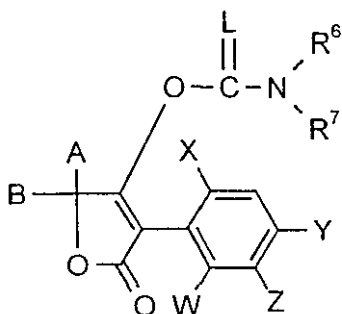
(I-2-e):



(I-2-f):



(1-2-g):

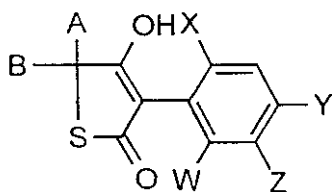


worin

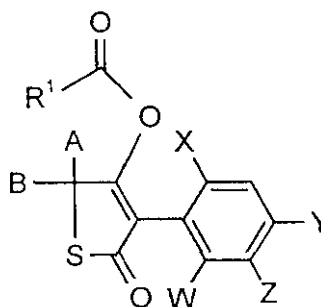
- 5 A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebene Bedeutung haben.

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

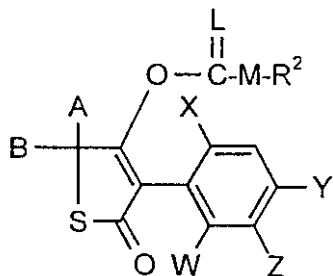
(I-3-a):



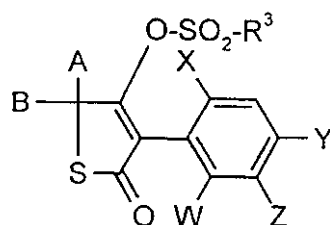
(I-3-b):



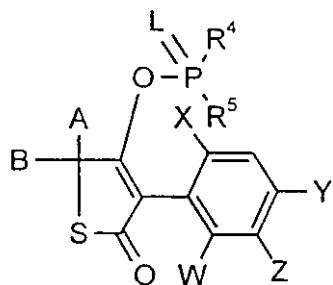
(I-3-c):



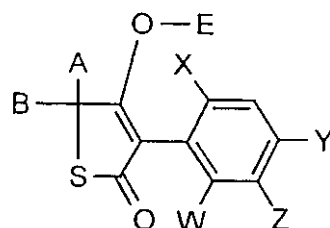
(I-3-d):



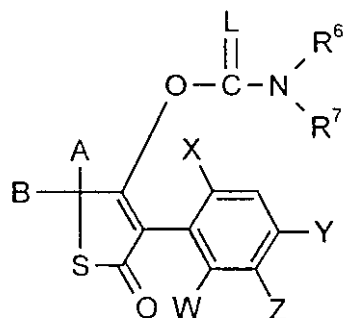
(I-3-e):



(I-3-f):



(I-3-g):



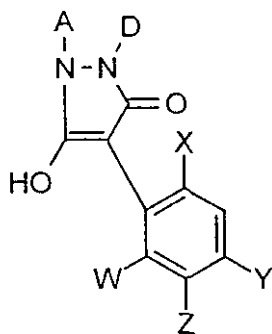
worin

5

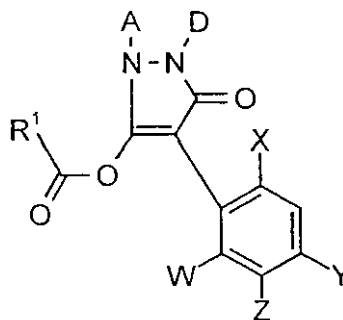
A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutung besitzen.

Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-4-a) bis (I-4-g), wenn CKE für die Gruppe (4) steht,

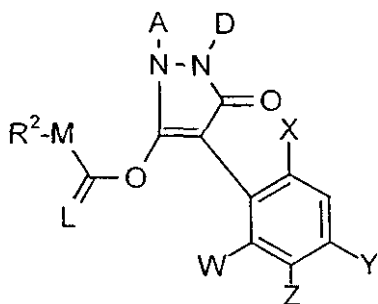
(I-4-a):



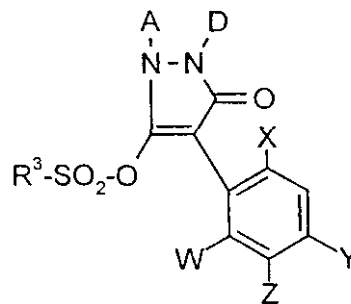
(I-4-b):



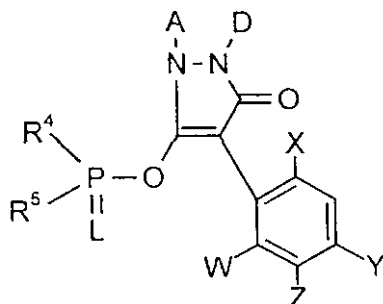
(I-4-c):



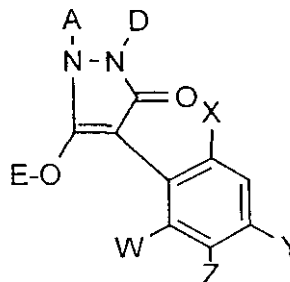
(I-4-d):



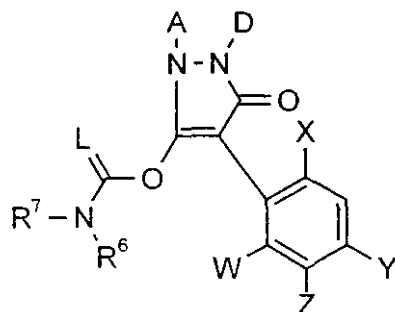
(I-4-e):



(I-4-f):



(I-4-g):

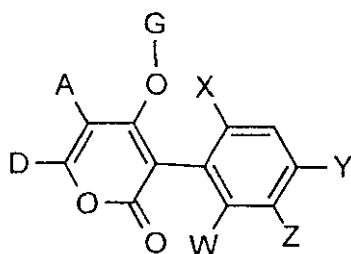


worin

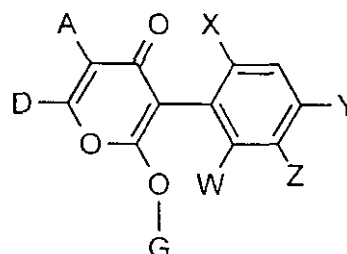
5 A, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen besitzen.

Die Verbindungen der Formel (I-5) können in Abhängigkeit von der Stellung des Substituenten G in den zwei isomeren Formen der Formeln (I-5-A) und (I-5-B) vor-

10



(I-5-A)



(I-5-B)

was durch die gestrichelte Linie in der Formel (I-5) zum Ausdruck gebracht werden soll.

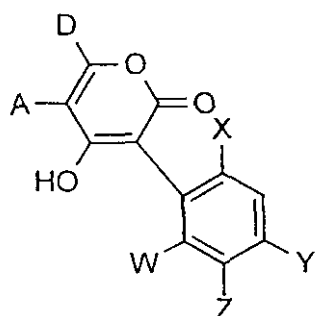
15 Die Verbindungen der Formeln (I-5-A) und (I-5-B) können sowohl als Gemische als auch in Form ihrer reinen Isomeren vorliegen. Gemische der Verbindungen der Formeln (I-5-A) und (I-5-B) lassen sich gegebenenfalls in an sich bekannter Weise durch

physikalische Methoden trennen, beispielsweise durch chromatographische Methoden.

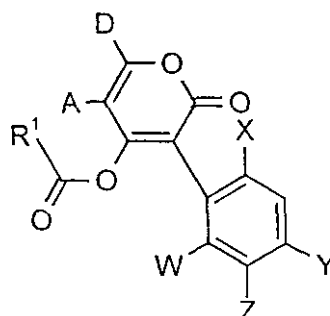
- 5 Aus Gründen der besseren Übersichtlichkeit wird im folgenden jeweils nur eines der möglichen Isomeren aufgeführt. Das schließt nicht aus, daß die Verbindungen gegebenenfalls in Form der Isomerengemische oder in der jeweils anderen isomeren Form vorliegen können.

- 10 Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-5-a) bis (I-5-g), wenn CKE für die Gruppe (5) steht,

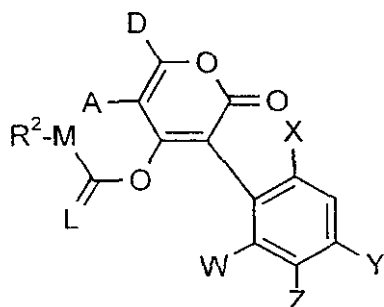
(I-5-a):



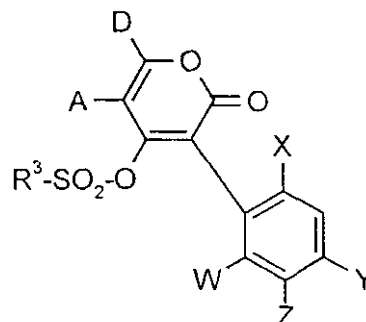
(I-5-b):



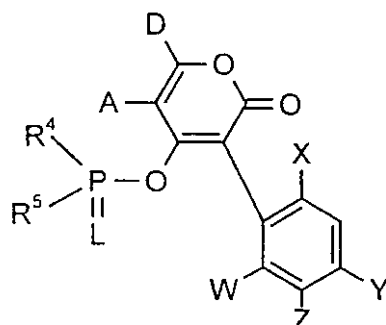
(I-5-c):



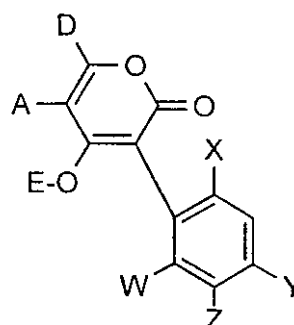
(I-5-d):



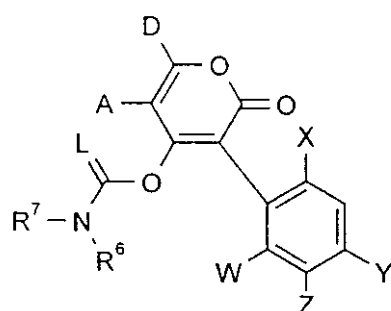
(I-5-e):



(I-5-f):



(I-5-g):



worin

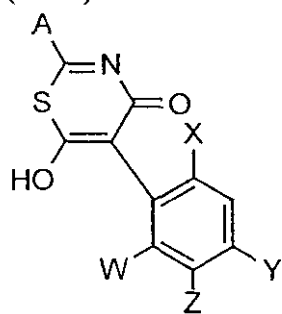
5

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

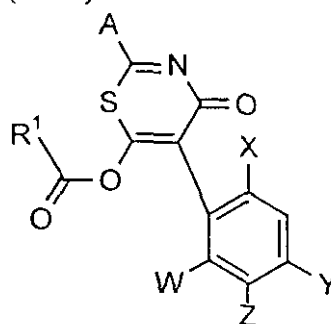
10

Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-6-a) bis (I-6-g), wenn CKE für die Gruppe (6) steht,

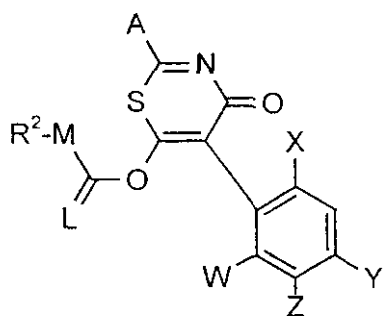
(I-6-a):



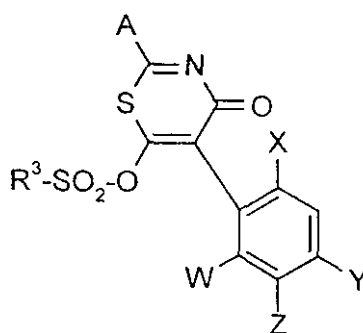
(I-6-b):



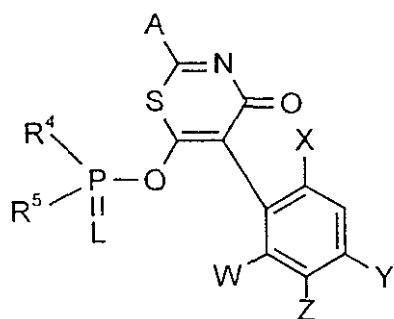
(I-6-c):



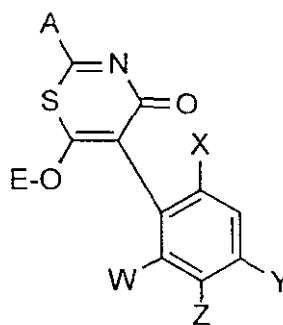
(I-6-d):



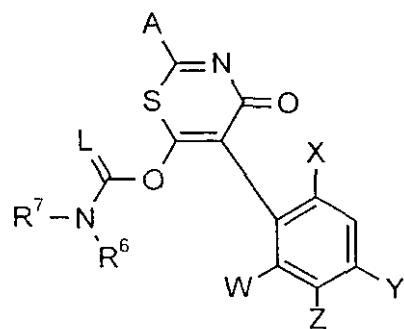
(I-6-e):



(I-6-f):



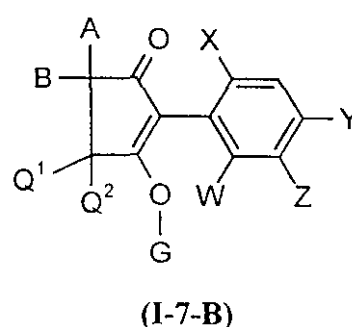
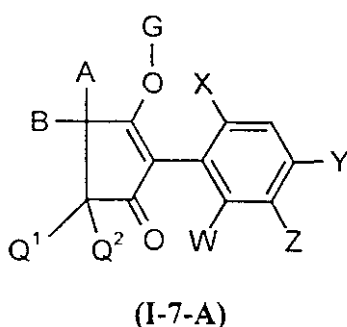
(I-6-g):



worin

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

- 5 Die Verbindungen der Formel (I-7) können in Abhängigkeit von der Stellung des Substituenten G in den zwei isomeren Formen der Formeln (I-7-A) und (I-7-B) vorliegen,



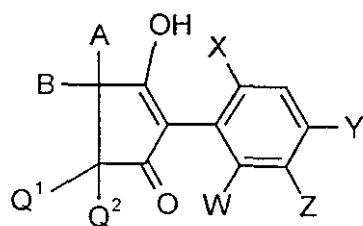
- 10 was durch die gestrichelte Linie in der Formel (I) zum Ausdruck gebracht werden soll.

- Die Verbindungen der Formeln (I-7-A) und (I-7-B) können sowohl als Gemische als auch in Form ihrer reinen Isomeren vorliegen. Gemische der Verbindungen der Formeln (I-7-A) und (I-7-B) lassen sich gegebenenfalls durch physikalische Methoden trennen, beispielsweise durch chromatographische Methoden.

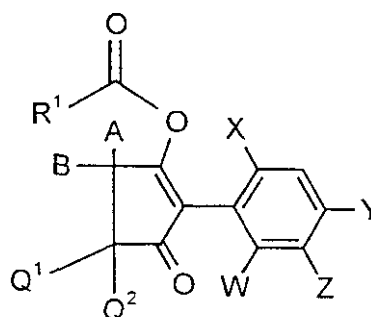
- Aus Gründen der besseren Übersichtlichkeit wird im folgenden jeweils nur eines der möglichen Isomeren aufgeführt. Das schließt nicht aus, daß die Verbindungen gegebenenfalls in Form der Isomerengemische oder in der jeweils anderen isomeren Form vorliegen können.

Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächlichen Strukturen (I-7-a) bis (I-7-g):

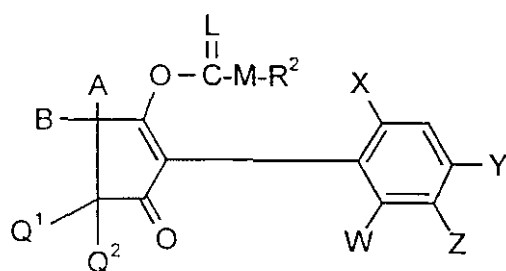
(I-7-a):



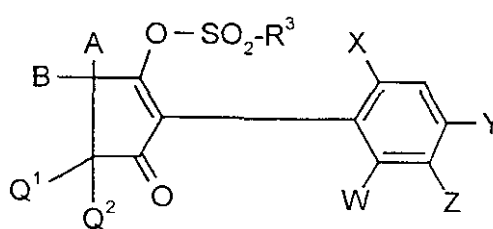
(I-7-b):



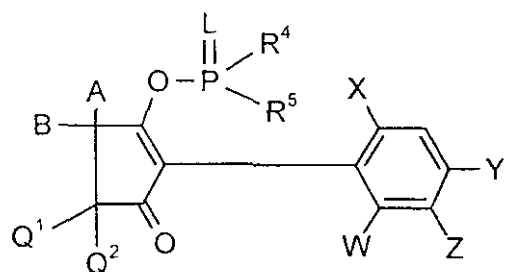
(I-7-c):



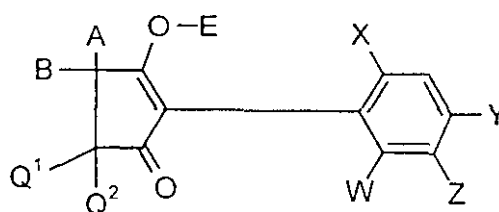
(I-7-d):



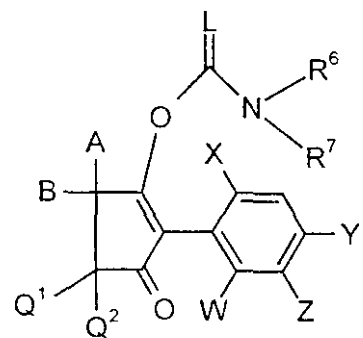
(I-7-e):



(I-7-f):



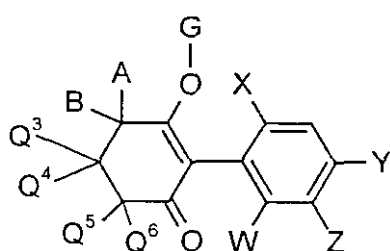
(I-7-g):



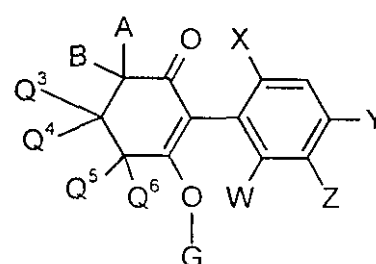
worin

A, B, Q¹, Q², E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen besitzen.

- 5 Die Verbindungen der Formel (I-8) können in Abhängigkeit von der Stellung des Substituenten G in den zwei isomeren Formen der Formeln (I-8-A) bzw. (I-8-B) vorliegen, was durch die gestrichelte Linie in der Formel (I-8) zum Ausdruck gebracht werden soll:



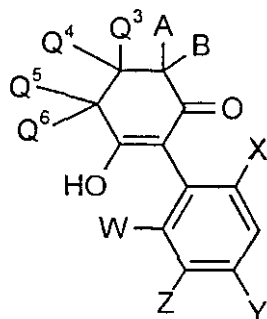
(I-8-A)



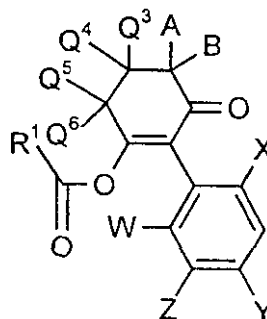
(I-8-B)

- 10 Die Verbindungen der Formeln (I-8-A) bzw. (I-8-B) können sowohl als Gemische als auch in Form ihrer reinen Isomeren vorliegen. Gemische der Verbindungen der Formeln (I-8-A) und (I-8-B) lassen sich gegebenenfalls durch physikalische Methoden trennen, beispielsweise durch chromatographische Methoden.
- 15 Aus Gründen der besseren Übersichtlichkeit wird im folgenden jeweils nur eines der möglichen Isomeren aufgeführt. Das schließt ein, daß die betreffende Verbindung gegebenenfalls als Isomerengemisch oder in der jeweils anderen isomeren Form vorliegen kann.
- 20 Unter Einbeziehung der verschiedenen Bedeutungen (a), (b), (c), (d), (e), (f) und (g) der Gruppe G ergeben sich folgende hauptsächlichen Strukturen (I-8-a) bis (I-8-g):

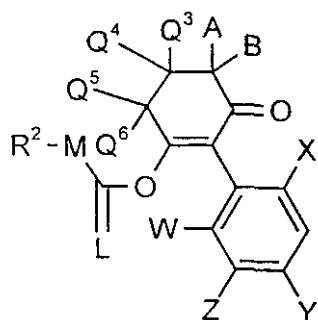
(I-8-a):



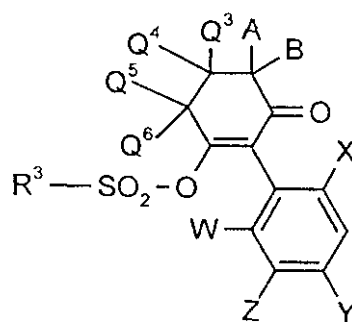
(I-8-b):



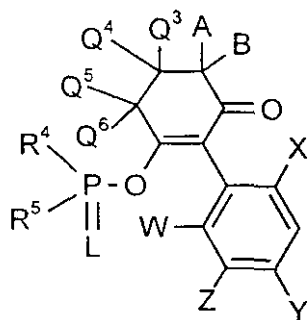
(I-8-c):



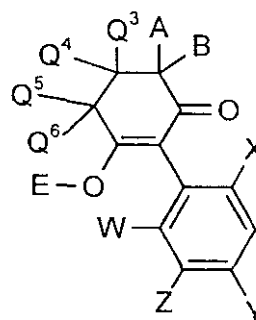
(I-8-d):



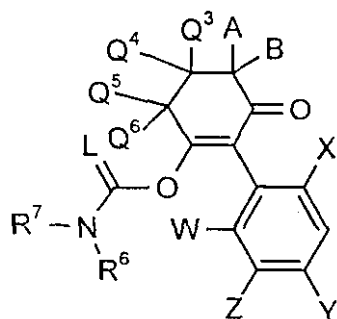
(I-8-e):



(I-8-f):



(I-8-g):

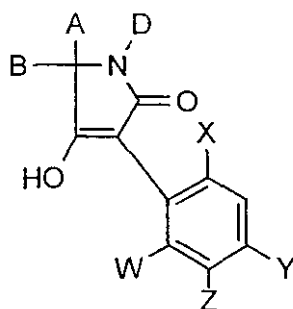


worin

5 A, B, E, L, M, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen besitzen.

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

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



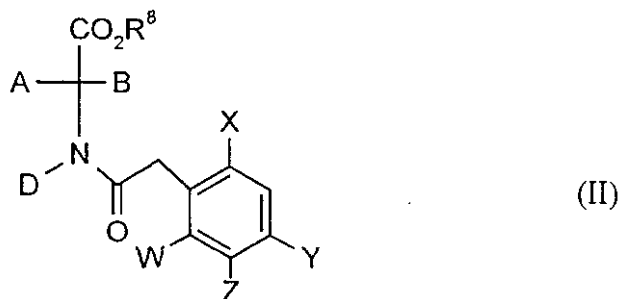
(I-1-a)

in welcher

- 15 A, B, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

wenn man

N-Acylaminosäureester der Formel (II)



in welcher

5

A, B, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

und

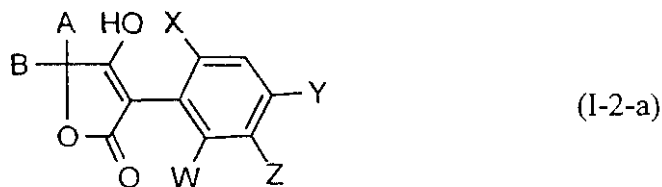
10

R⁸ für Alkyl (bevorzugt C₁-C₆-Alkyl) steht,

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

15

(B) Außerdem wurde gefunden, daß man substituierte 3-Phenyl-4-hydroxy- Δ^3 -dihydrofuranon-Derivate der Formel (I-2-a)



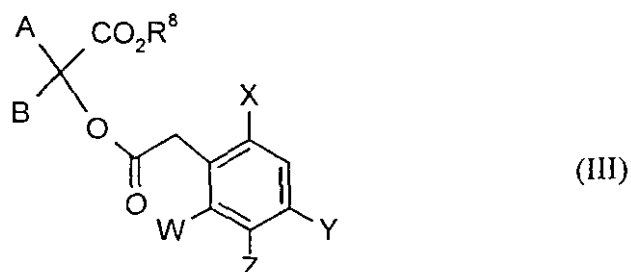
in welcher

20

A, B, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man

Carbonsäureester der Formel (III)

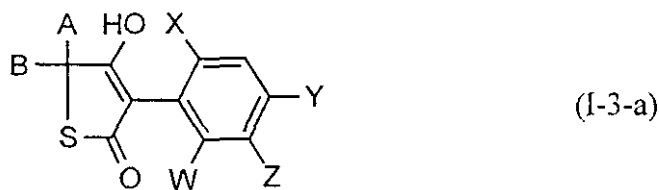


5 in welcher

A, B, W, X, Y, Z und R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

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

(C) Weiterhin wurde gefunden, daß man substituierte 3-Phenyl-4-hydroxy- Δ^3 -dihydrothiophenon-Derivate der Formel (I-3-a)



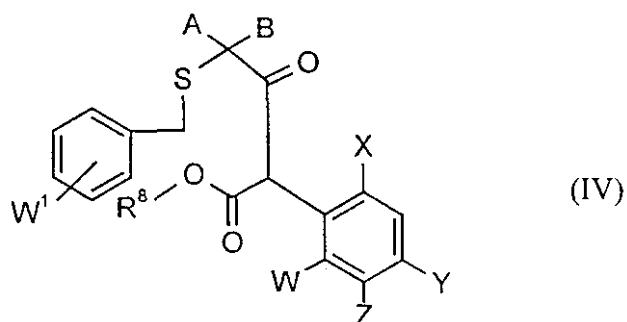
15

in welcher

A, B, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20 erhält, wenn man

β -Ketocarbonsäureester der Formel (IV)



in welcher

A, B, W, X, Y, Z und R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben und

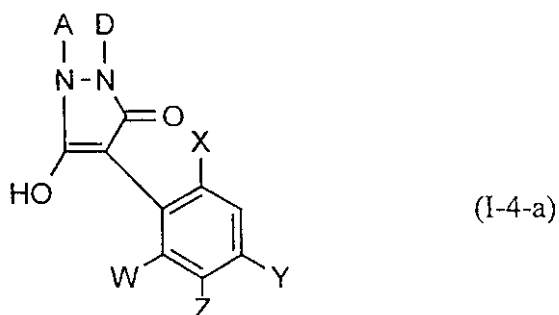
5

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

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

10

(D) Weiterhin erhält man substituierte 3-Hydroxy-4-phenyl-5-oxo-pyrazoline der Formel (I-4-a)



15

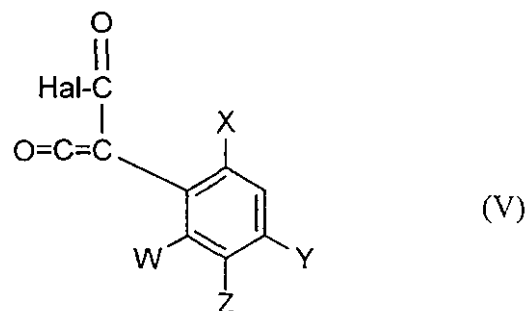
in welcher

A, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

wenn man

20

(α) Halogencarbonylketene der Formel (V)



in welcher

5 W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben

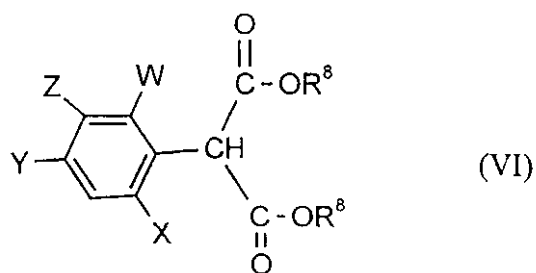
und

Hal für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht,

10

oder

(β) Malonsäurederivate der Formel (VI)



15

in welcher

R^8 , W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20 mit Hydrazinen der Formel (VII)



in welcher

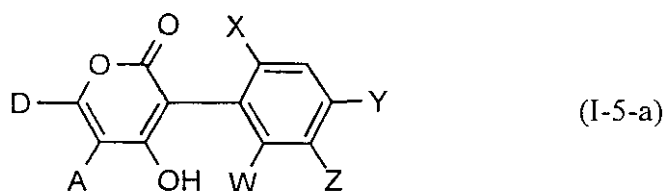
A und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt.

(E) Weiterhin wurde gefunden, daß man die neuen substituierten 3-Phenylpyron-Derivate der Formel (I-5-a)

10



in welcher

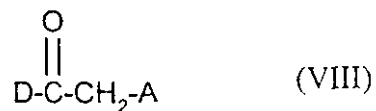
15

A, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man

Carbonylverbindungen der Formel (VIII)

20



in welcher

A und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

oder deren Silylenolether der Formel (VIIIa)

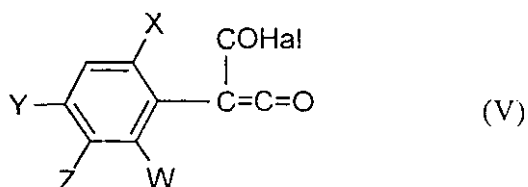
- 29 -



in welcher

5 A, D und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Ketensäurehalogeniden der Formel (V)



10 in welcher

W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Halogen (vorzugsweise für Chlor oder Brom) steht,

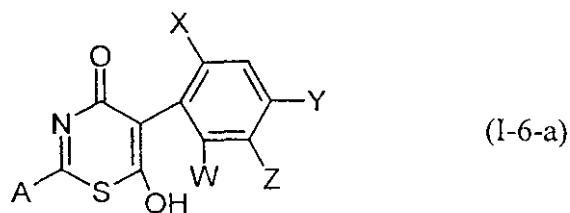
15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt.

Weiterhin wurde gefunden,

20

(F) daß man die neuen substituierten Phenyl-1,3-thiazin-Derivate der Formel (I-6-a)



in welcher

A, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

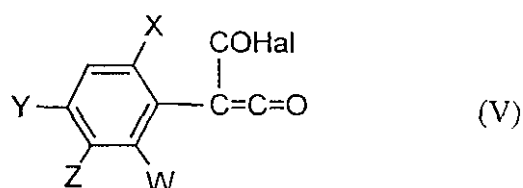
5 erhält, wenn man Thioamide der Formel (IX)



in welcher

10 A die oben angegebene Bedeutung hat,

mit Ketensäurehalogeniden der Formel (V)



15 in welcher

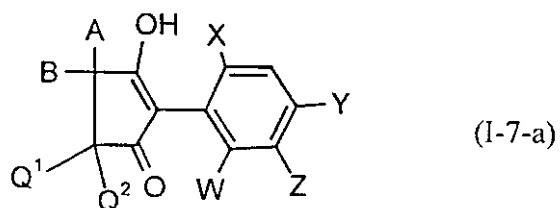
Hal, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
20 Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt.

Weiterhin wurde gefunden,

(G) daß man Verbindungen der Formel (I-7-a)

25



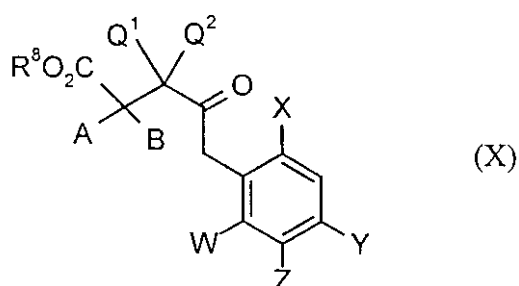
in welcher

A, B, Q¹, Q², W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

5

erhält, wenn man

Ketocarbonsäureester der Formel (X)



10

in welcher

A, B, Q¹, Q², W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben, und

15

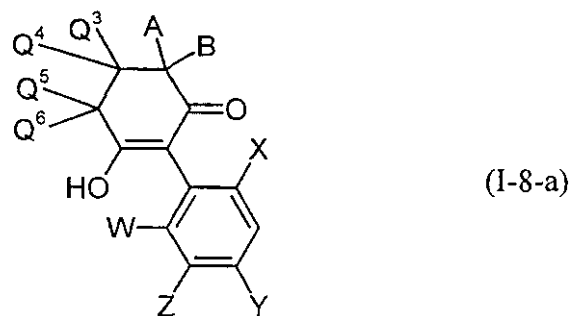
R⁸ für Alkyl (insbesondere C₁-C₈-Alkyl) steht,

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

20

Außerdem wurde gefunden,

(H) daß man Verbindungen der Formel (I-8-a)



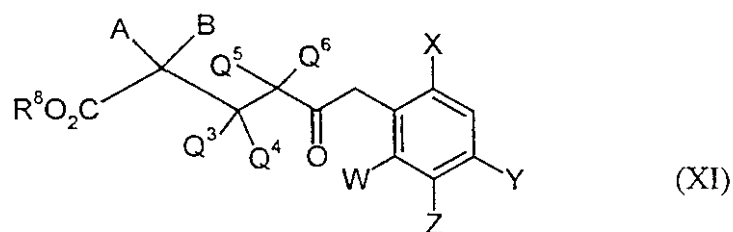
in welcher

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

5

erhält, wenn man

6-Aryl-5-keto-hexansäureester der Formel (XI)



10

in welcher

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben

und

15

R⁸ für Alkyl (bevorzugt C₁-C₆-Alkyl) steht,

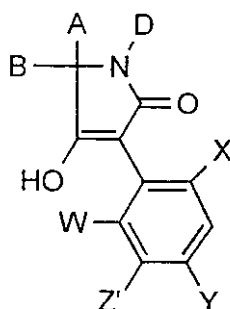
in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert;

20

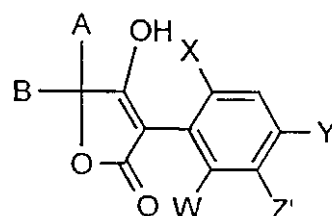
- (I) daß man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben

angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formel
(I-1'-a) bis (I-8'-a),

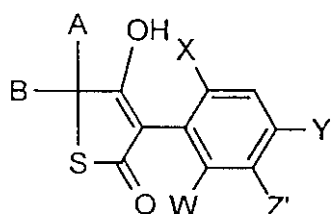
(I-1'-a):



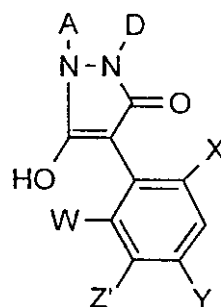
(I-2'-a):



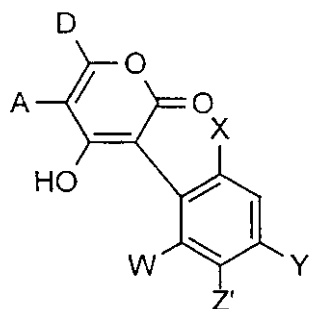
(I-3'-a):



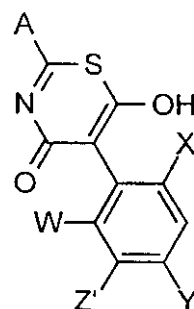
(I-4'-a):



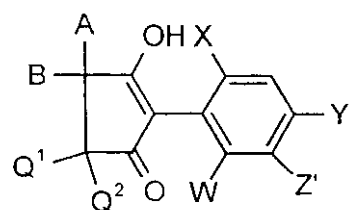
(I-5'-a):



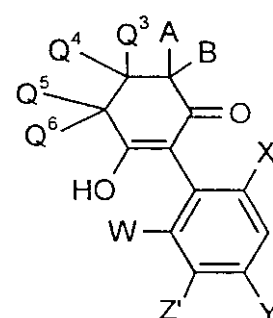
(I-6'-a):



(I-7'-a):



(I-8'-a):



in welchen

5 A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X und Y die oben angegebene
Bedeutung haben und

Z' für Chlor, Brom, Jod, bevorzugt für Brom steht,

10 mit Boronsäuren der Formel (XII)



in welcher

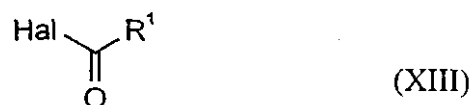
15 Z die oben angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Lösungsmittels, einer Base und eines Katalysators
umsetzt, wobei als Katalysator insbesondere Palladiumkomplexe in Frage
kommen.

20 Außerdem wurde gefunden

(J) daß man die Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-b) bis (I-8-b), in
welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R¹, W, X, Y und Z die oben
angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der oben
25 gezeigten Formeln (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵,
Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

(α) mit Säurehalogeniden der Formel (XIII)



in welcher

R^1 die oben angegebene Bedeutung hat und

5

Hal für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht

oder

10 (B) mit Carbonsäureanhydriden der Formel (XIV)



in welcher

15

R^1 die oben angegebene Bedeutung hat,

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

20

(K) daß man die Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-c) bis (I-8-c), in welchen A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^2 , M, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und L für Sauerstoff steht, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

25

mit Chlorameisensäureestern oder Chlorameisensäurethioestern der Formel (XV)



in welcher

5

R^2 und M die oben angegebenen Bedeutungen haben,

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

10

(L) daß man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-c) bis (I-8-c), in welchen A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^2 , M, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und L für Schwefel steht, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

15

mit Chlormonothioameisensäureestern oder Chlordithioameisensäureestern der Formel (XVI)



20

in welcher

M und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

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

und

- (M) daß man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-d) bis (I-8-d), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R³, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

mit Sulfonsäurechloriden der Formel (XVII)



10

in welcher

R³ die oben angegebene Bedeutung hat,

- 15 gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt,

- (N) daß man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-e) bis (I-8-e), in welchen A, B, D, L, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R⁴, R⁵, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

mit Phosphorverbindungen der Formel (XVIII)



25

in welcher

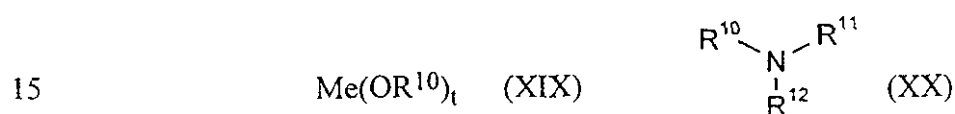
L, R⁴ und R⁵ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht,

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

(L) daß man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-f) bis (I-8-f), in
welchen A, B, D, E, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angege-
benen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formeln
10 (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und
Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

mit Metallverbindungen oder Aminen der Formeln (XIX) oder (XX)



in welchen

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

t für die Zahl 1 oder 2 und

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

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

(P) daß man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-g) bis (I-8-g), in welchen A, B, D, L, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R⁶, R⁷, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, erhält, wenn man Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, jeweils

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



10

in welcher

R⁶ und L die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

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

(β) mit Carbamidsäurechloriden oder Thiocarbamidsäurechloriden der Formel (XXII)



20

in welcher

L, R⁶ und R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

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

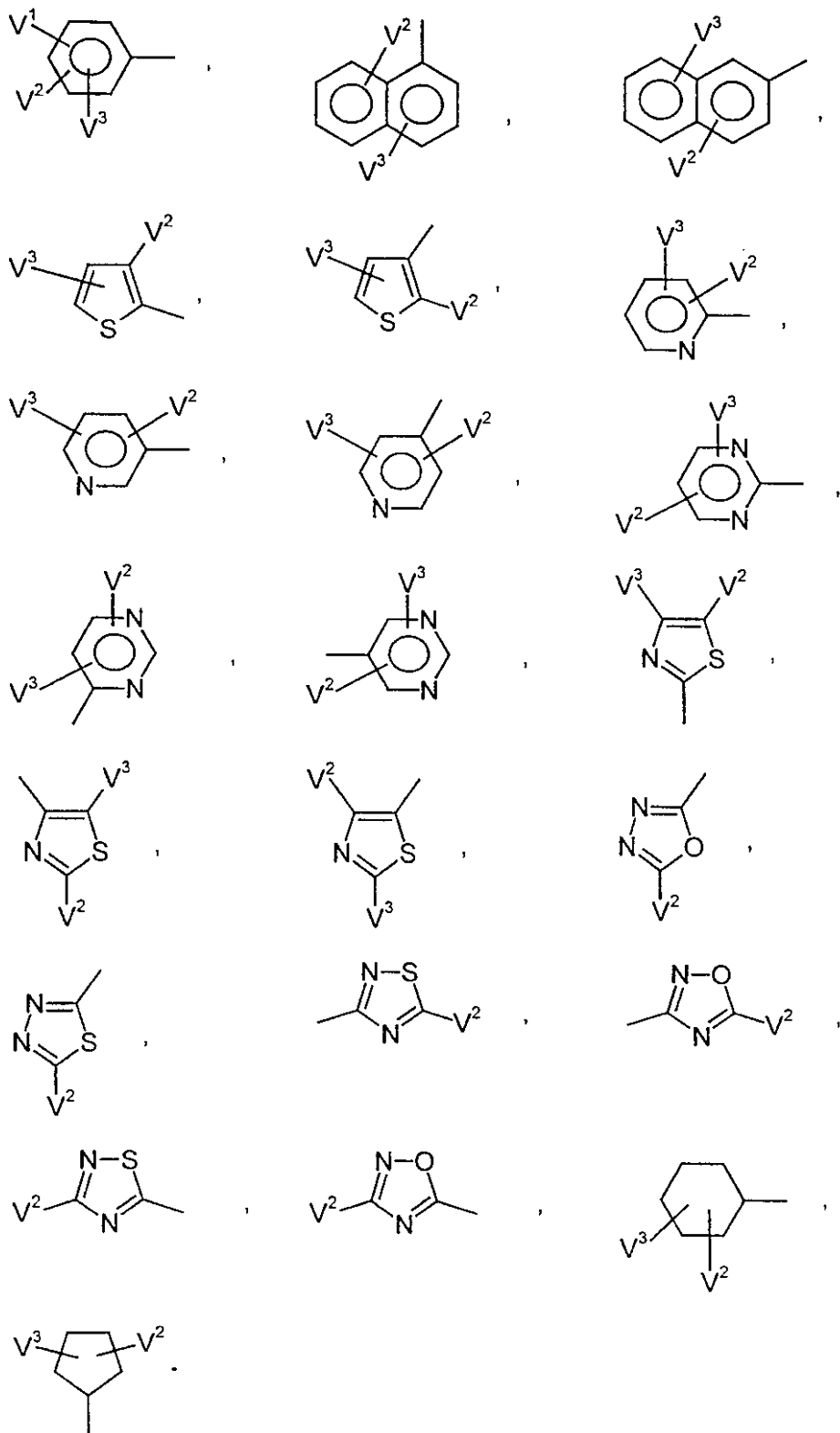
Weiterhin wurde gefunden, daß die neuen Verbindungen der Formel (I) eine sehr gute Wirksamkeit als Schädlingsbekämpfungsmittel, vorzugsweise als Insektizide, Akarizide und als Herbizide aufweisen.

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

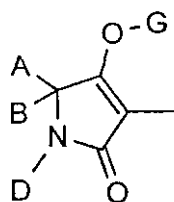
- 10 X steht bevorzugt für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, Nitro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyloxy oder Benzylthio.

15

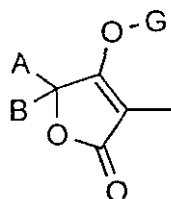
Z steht bevorzugt für einen der Reste



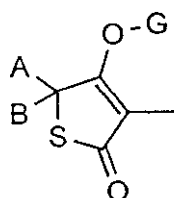
- V¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls
 5 einfach oder mehrfach durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkylthio.
- 10 V² und V³ stehen bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy.
- W und Y stehen bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Nitro
 15 oder Cyano.
- CKE steht bevorzugt für eine der Gruppen



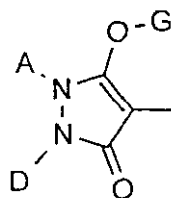
(1),



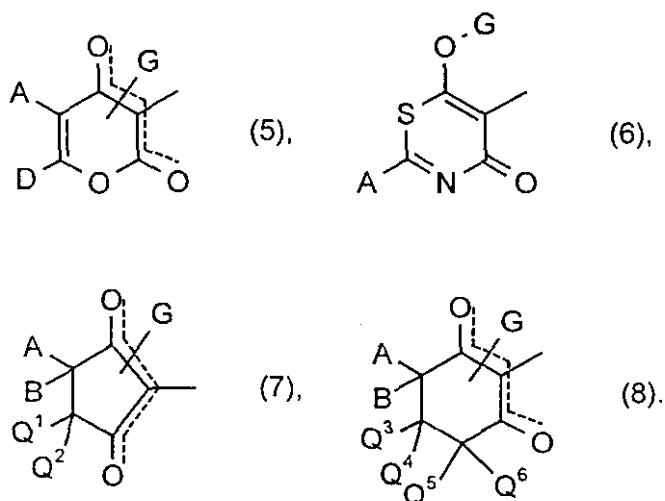
(2),



(3),



(4),



- 5 A steht bevorzugt für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht
- 10 direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes C₆- oder C₁₀-Aryl (Phenyl oder Naphthyl), Hetaryl mit 5 oder 6 Ringatomen (beispielsweise Furanyl, Pyridyl, Imidazolyl, Triazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Thiazolyl oder Thienyl) oder C₆- oder C₁₀-Aryl-C₁-C₆-alkyl (Phenyl-C₁-C₆-alkyl oder Naphthyl-C₁-C₆-alkyl).
- 15

B steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₁₂-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl oder

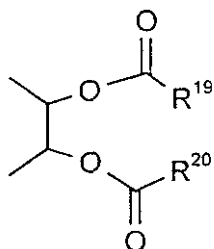
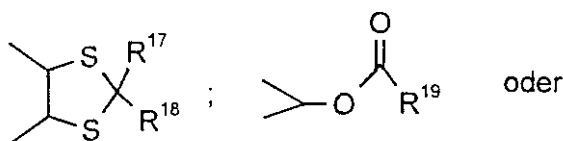
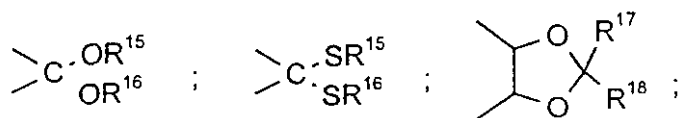
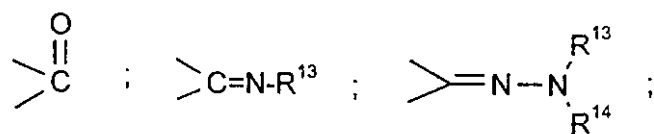
20

A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für gesättigtes C₃-C₁₀-Cycloalkyl oder ungesättigtes C₅-C₁₀-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welche gegebenenfalls einfach oder zweifach durch C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₁₀-

Cycloalkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, Halogen oder Phenyl substituiert sind oder

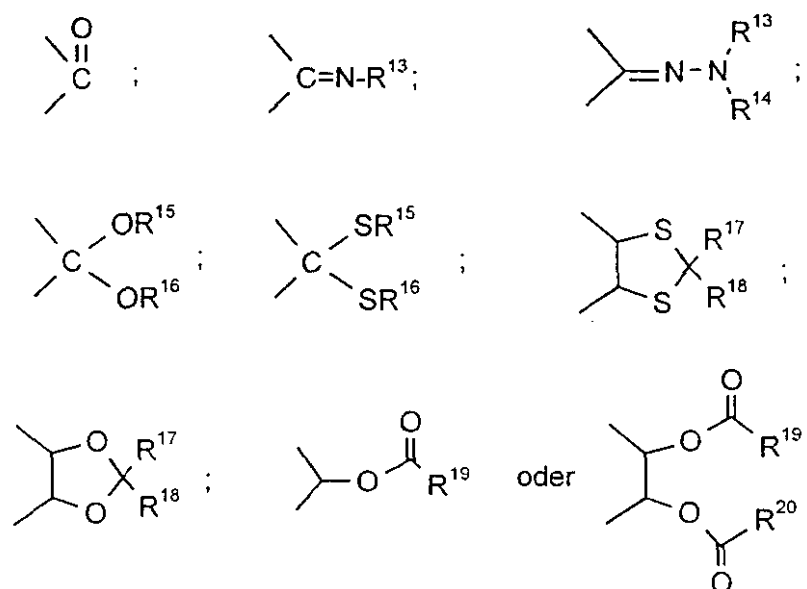
- 5 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für C₃-C₆-Cycloalkyl, welches durch eine gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthaltende Alkylendiyl-, oder durch eine Alkylendioxy- oder durch eine Alkylendithioyl-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- bis achtegliedrigen Ring bildet oder
- 10 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₅-C₈-Cycloalkenyl, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder Halogen substituiertes C₂-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl oder C₄-C₆-Alkandiendiyl
- 15 stehen, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.
- 20 D steht bevorzugt für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkynyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder jeweils gegeben-
- 25 enfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Hetaryl mit 5 oder 6 Ringatomen (beispielsweise Furanyl, Imidazolyl, Pyridyl, Thiazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Pyrrolyl, Thienyl oder Triazolyl), Phenyl-C₁-C₆-alkyl oder Hetaryl-C₁-C₆-alkyl mit 5 oder 6 Ringatomen (beispielsweise Furanyl-,
- 30 Imidazolyl-, Pyridyl-, Thiazolyl-, Pyrazolyl-, Pyrimidyl-, Pyrrolyl-, Thienyl- oder Triazolyl-C₁-C₆-alkyl) oder

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



enthalten ist, oder

- 5 A und Q¹ stehen gemeinsam bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, durch jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₇-Cycloalkyl oder durch jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes Benzyloxy oder Phenyl substituiertes C₃-C₆-Alkandiyl oder C₄-C₆-Alkendiyl, welches außerdem gegebenenfalls eine der nachstehenden Gruppen
- 10



enthält oder durch eine C_1 - C_2 -Alkandiylgruppe oder durch ein Sauerstoffatom überbrückt ist oder

5 Q^1 steht bevorzugt für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl.

Q^2 , Q^4 , Q^5 und Q^6 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl.

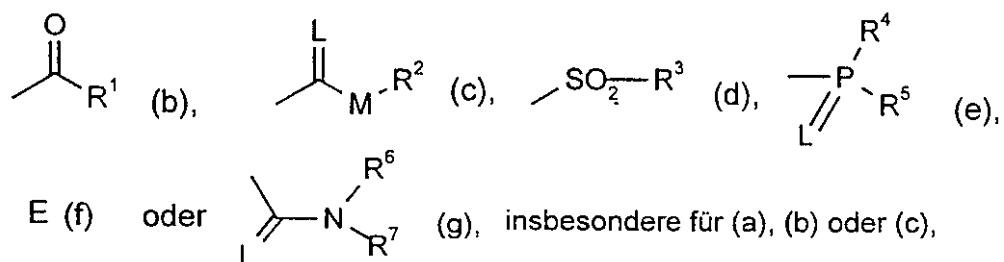
10 Q^3 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_2 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkylthio- C_1 - C_2 -alkyl, gegebenenfalls durch C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes C_3 - C_8 -Cycloalkyl, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Halogenalkyl,

15 C_1 - C_2 -Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder

Q^3 und Q^4 stehen bevorzugt gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl substituierten C_3 - C_7 -Ring, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

20

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



in welchen

5 E für ein Metallion oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

M für Sauerstoff oder Schwefel steht.

10

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

15

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

20

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

25

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

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

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

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

15 für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl oder

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

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

30 R⁴ und R⁵ stehen bevorzugt unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkyl-amino, Di-(C₁-C₈-alkyl)amino, C₁-C₈-Alkylthio, C₂-C₈-Alkenylthio, C₃-C₇-Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Nitro,

Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio.

5 R⁶ und R⁷ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Phenyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Alkyl, 10 C₁-C₈-Halogenalkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Benzyl oder zusammen für einen gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl substituierten C₃-C₆-Alkylenrest, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

15 R¹³ steht bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro 20 oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkoxy.

R¹⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₈-Alkyl oder

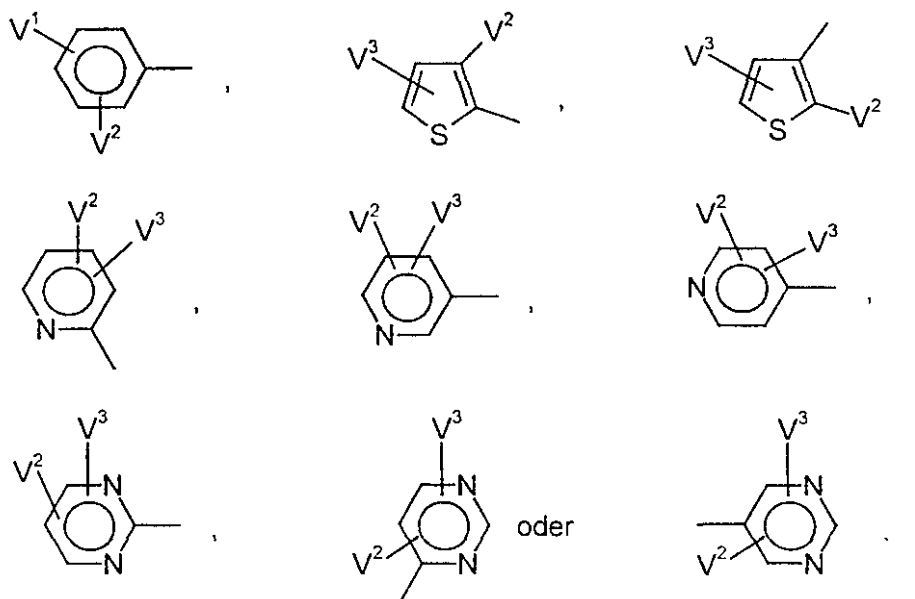
25

R¹³ und R¹⁴ stehen gemeinsam bevorzugt für C₄-C₆-Alkandiyl.

R¹⁵ und R¹⁶ sind gleich oder verschieden und stehen bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl oder

30

- 5 R¹⁵ und R¹⁶ stehen gemeinsam bevorzugt für einen C₂-C₄-Alkandiylrest, der gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder durch gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl substituiert ist.
- 10 R¹⁷ und R¹⁸ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl oder
- 15 R¹⁷ und R¹⁸ stehen gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für eine Carbonylgruppe oder für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₅-C₇-Cycloalkyl, in dem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.
- 20 R¹⁹ und R²⁰ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₁-C₁₀-Alkoxy, C₁-C₁₀-Alkylamino, C₃-C₁₀-Alkenylamino, Di-(C₁-C₁₀-alkyl)amino oder Di-(C₃-C₁₀-alkenyl)amino.
- 25 In den als bevorzugt genannten Restedefinitionen steht Halogen für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.
- X steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyloxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₄-Halogenalkenyloxy, Nitro oder Cyano.
- Z steht besonders bevorzugt für einen der Reste

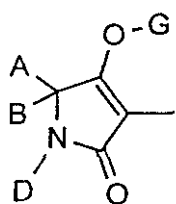


5 V^1 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Halogenalkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkoxy, Nitro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Halogenalkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenoxy- C_1 - C_2 -alkyl, Phenyl- C_1 - C_2 -alkoxy, Phenylthio- C_1 - C_2 -alkyl oder Phenyl- C_1 - C_2 -alkylthio.

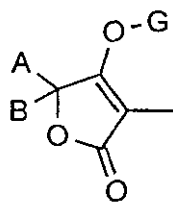
10 V^2 und V^3 stehen besonders bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Halogenalkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy.

15 W und Y stehen besonders bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy.

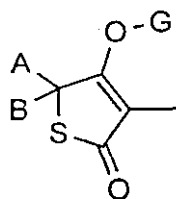
CKE steht besonders bevorzugt für eine der Gruppen



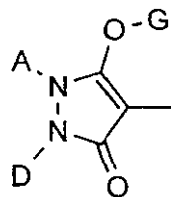
(1),



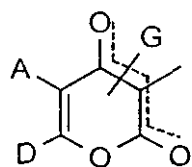
(2),



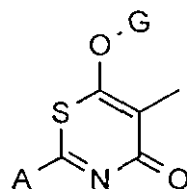
(3),



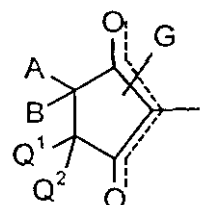
(4),



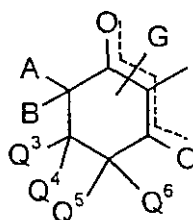
(5),



(6),



(7),



(8).

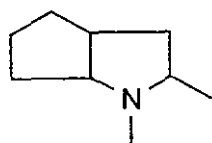
5

- A steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls
 10 durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₆-
 alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy
 substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied
 durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder (jedoch nicht im Fall der
 Verbindungen der Formeln (I-5), (I-7) und (I-8)) jeweils gegebenenfalls durch
 15 Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder
 C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl, Furanyl, Pyridyl, Imidazolyl,
 Triazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Thiazolyl, Thienyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl.

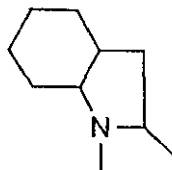
- B steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl oder
- 5 A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen besonders bevorzugt für gesättigtes oder ungesättigtes C₅-C₇-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch C₁-C₆-Alkyl, C₅-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Fluor, Chlor oder Phenyl substituiert ist oder
- 10 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen besonders bevorzugt für C₅-C₆-Cycloalkyl, welches durch eine gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Sauerstoff- oder Schwefelatome enthaltende Alkylendiyl- oder durch eine Alkylendioxy- oder durch eine Alkylendithiol-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- oder sechsgliedrigen Ring bildet oder
- 15 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen besonders bevorzugt für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₅-Alkoxy, Fluor, Chlor
- 20 oder Brom substituiertes C₂-C₄-Alkandiyl oder C₂-C₄-Alkendiyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für Butadiendiyl stehen.
- 25 D steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl oder C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder (jedoch nicht im Fall
- 30 der Verbindungen der Formeln (I-1) und (I-4)) für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-

Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl, Furanyl, Imidazolyl, Pyridyl, Thiazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Pyrrolyl, Thienyl, Triazolyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder

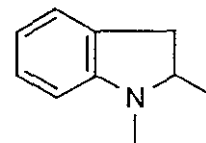
- 5 A und D stehen gemeinsam besonders bevorzugt für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₅-Alkandiyl, in welchem eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe, Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein kann, wobei als Substituenten Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy in Frage kommen oder
- 10 A und D stehen (im Fall der Verbindungen der Formel (I-1)) gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für eine der Gruppen AD-1 bis AD-10:



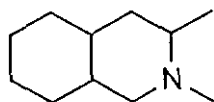
AD-1



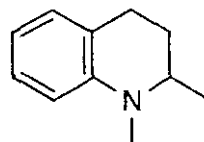
AD-2



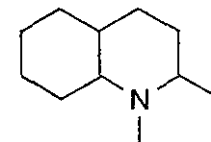
AD-3



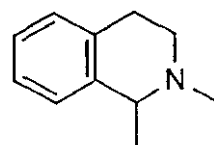
AD-4



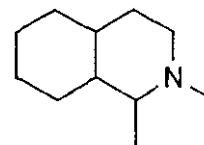
AD-5



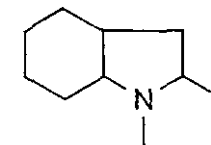
AD-6



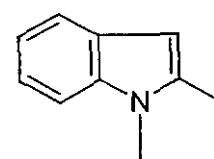
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

oder

5 A und Q¹ stehen gemeinsam besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, durch jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl oder C₃-C₄-Alkendiyl oder

10 Q¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff.

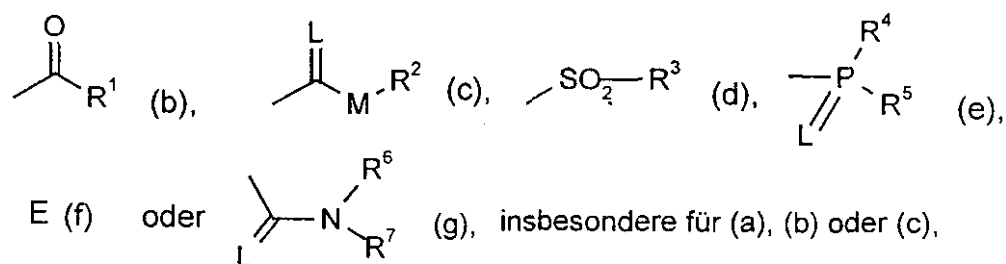
Q² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff.

15 Q⁴, Q⁵ und Q⁶ stehen besonders bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl.

20 Q³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₂-alkyl oder gegebenenfalls durch Methyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder

25 Q³ und Q⁴ stehen besonders bevorzugt gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten gesättigten C₅-C₆-Ring, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

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



in welchen

E für ein Metallion oder ein Ammoniumion steht,

5

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

M für Sauerstoff oder Schwefel steht.

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

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Phenyl,
20

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl oder C₁-C₃-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl-C₁-C₄-alkyl,
25

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

5 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Phenoxy-C₁-C₃-alkyl oder

für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Amino oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Pyridyloxy-C₁-C₃-alkyl, Pyrimidyloxy-C₁-C₃-alkyl oder Thiazolyloxy-C₁-C₃-alkyl.

10

R² steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl oder Poly-C₁-C₆-alkoxy-C₂-C₆-alkyl,

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

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

20

R³ steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl.

25

R⁴ und R⁵ stehen besonders bevorzugt unabhängig voneinander für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₄-Alkenylthio, C₃-C₆-Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-

30

Halogenalkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Halogenalkylthio, C₁-C₃-Alkyl
oder C₁-C₃-Halogenalkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio.

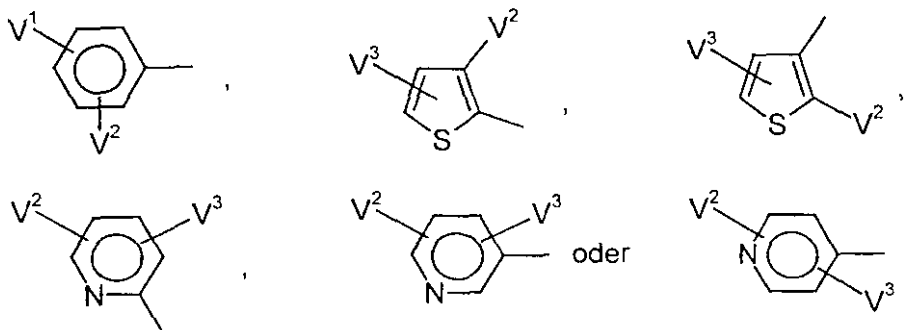
- R⁶ und R⁷ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-
5 C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-
Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₃-
Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, für
gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl
oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Benzyl, oder zusammen für einen
10 gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl substituierten C₄-C₅-Alkylrest, in
welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder
Schwefel ersetzt ist.

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

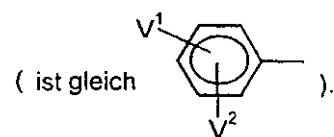
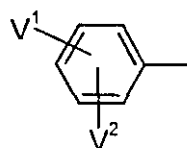
- X steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Propyl, iso-
Propyl, Methoxy, Ethoxy, Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Difluor-
methoxy, Trifluormethoxy, Nitro oder Cyano.

20

- Z steht ganz besonders bevorzugt für einen der Reste



insbesondere für

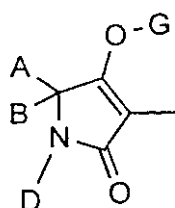


V¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Cyano oder gegebenenfalls einfach durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl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

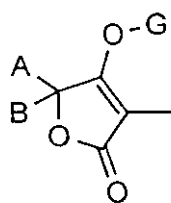
V² und V³ stehen ganz besonders bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy.

W und Y stehen ganz besonders bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Methoxy, Ethoxy oder Propoxy.

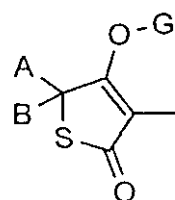
15 CKE steht ganz besonders bevorzugt für eine der Gruppen



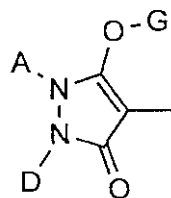
(1),



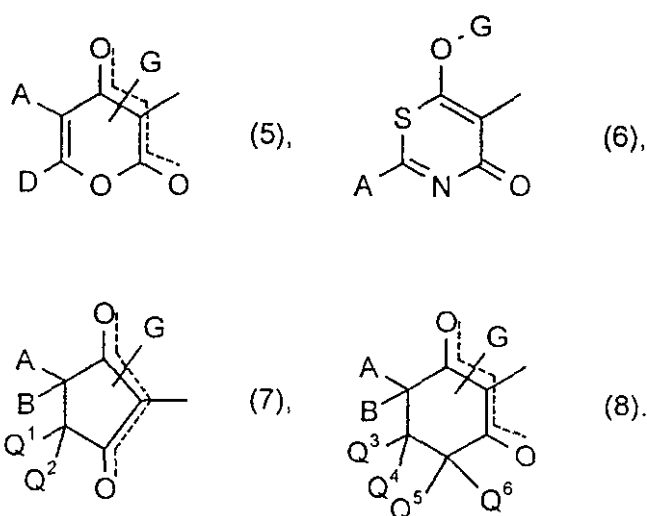
(2),



(3),



(4),



A steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Methyl, Ethyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder (jedoch nicht im Fall der Verbindungen der Formeln (I-5), (I-7) und (I-8)) für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl.

B steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl oder

A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen ganz besonders bevorzugt für gesättigtes C₅-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, iso-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Propoxy, iso-Propoxy, Butoxy, iso-Butoxy, sek.-Butoxy, tert.-Butoxy, Fluor oder Chlor substituiert ist oder

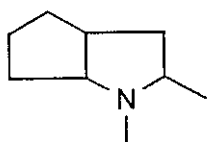
5 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen ganz besonders bevorzugt für C₅-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl, worin zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für C₂-C₄-Alkandiyl oder C₂-C₄-Alkendiyl, worin jeweils gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für Butadiendiyl stehen.

10 D steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder (jedoch nicht im Fall der Verbindungen der Formeln (I-1) und (I-4)) für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy
15 substituiertes Phenyl, Furanyl, Pyridyl, Thienyl oder Benzyl,
oder

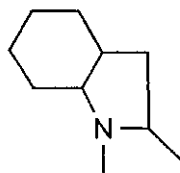
A und D stehen gemeinsam ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl, worin gegebenenfalls ein Kohlenstoffatom durch
20 Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls durch Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiert ist oder

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

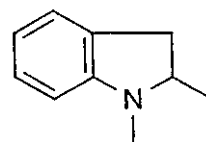
25



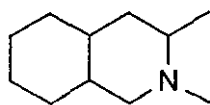
AD-1



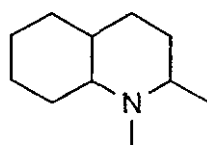
AD-2



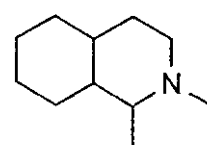
AD-3



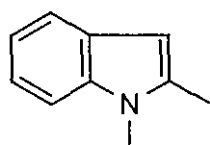
AD-4



AD-6



AD-8



AD-10

A und Q¹ stehen gemeinsam ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Hydroxy, Methyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl oder Butendiyl oder

5

Q¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.

Q² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.

10 Q⁴, Q⁵ und Q⁶ stehen ganz besonders bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.

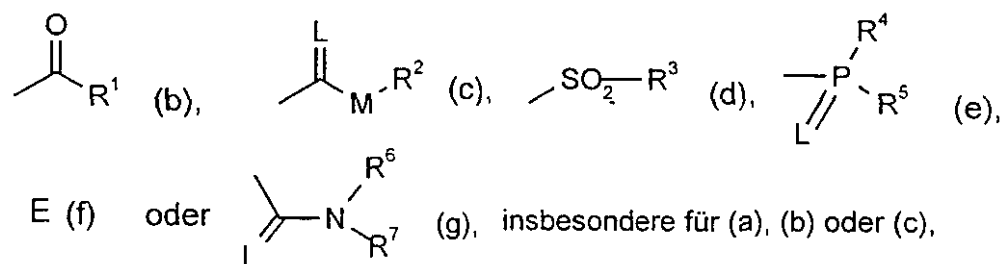
Q³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder

15

Q³ und Q⁴ stehen ganz besonders bevorzugt gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an den sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch Methyl oder Methoxy substituierten gesättigten C₅-C₆-Ring, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

20

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



in welchen

E für ein Metallion oder ein Ammoniumion steht,

5

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

M für Sauerstoff oder Schwefel steht.

10 R¹ steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, Poly-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy oder iso-Propoxy substituier-
 15 tes C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind,

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Phenyl,
 20

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Benzyl,
 25

- für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Furanyl, Thienyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Thiazolyl oder Pyrazolyl,
- 5 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Phenoxy- C_1 - C_2 -alkyl oder
- für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Amino, Methyl oder Ethyl substituiertes Pyridyloxy- C_1 - C_2 -alkyl, Pyrimidyloxy- C_1 - C_2 -alkyl oder Thiazolyloxy- C_1 - C_2 -alkyl.
- 10 R^2 steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C_1 - C_{14} -Alkyl, C_2 - C_{14} -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl oder Poly- C_1 - C_4 -alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl,
- 15 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl oder Methoxy substituiertes C_3 - C_6 -Cycloalkyl,
- oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl.
- 20 R^3 steht ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, tert.-Butyl, Methoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl.
- 25 R^4 und R^5 stehen ganz besonders bevorzugt unabhängig voneinander für C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di-(C_1 - C_4 -alkyl)amino, C_1 - C_4 -Alkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C_1 - C_2 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Fluoralkoxy, C_1 - C_2 -Alkylthio, C_1 - C_2 -Fluoralkylthio oder C_1 - C_3 -Alkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio.
- 30

5 R⁶ und R⁷ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy substituiertes Benzyl, oder zusammen für einen C₅-C₆-Alkylrest, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

10

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen bzw. Erläuterungen können untereinander, also auch zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

15

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

20

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

25

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

30

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

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

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

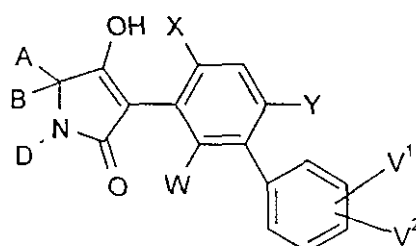

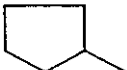
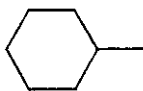


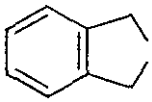
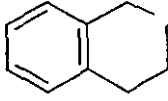
Tabelle 1: W = H; X = CH₃, Y = H, V¹ = H, V² = H.

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

Fortsetzung Tabelle 1:

A	B	D
C_4H_9	CH_3	H
i- C_4H_9	CH_3	H
s- C_4H_9	CH_3	H
t- C_4H_9	CH_3	H
C_2H_5	C_2H_5	H
C_3H_7	C_3H_7	H
	CH_3	H
	CH_3	H
	CH_3	H
$-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-(CH_2)_5-$		H
$-(CH_2)_6-$		H
$-(CH_2)_7-$		H
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$		H


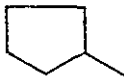
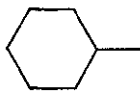

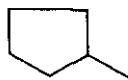
Fortsetzung Tabelle 1:

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

Fortsetzung Tabelle 1:

A	D	B
	$-(CH_2)_3-$	H
	$-(CH_2)_4-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-CH_2-$	H

Fortsetzung Tabelle 1:

A	D	B
	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CHCH}_3-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$	H
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---} \\ \quad \quad \quad \quad \quad \\ \quad \quad \quad \text{(CH}_2\text{)}_3 \end{array}$	H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	i- C_3H_7	H
H		H
H		H
H		H
CH_3	CH_3	H
CH_3	C_2H_5	H
CH_3	C_3H_7	H
CH_3	i- C_3H_7	H
CH_3		H
CH_3		H

Fortsetzung Tabelle 1:

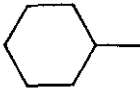
A	D	B
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

Tabelle 2: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

5 **Tabelle 3:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

Tabelle 4: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 4-Cl; V² = H.

10

Tabelle 5: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.

15 **Tabelle 6:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.

Tabelle 7: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 3-Cl; V² = H.

20 **Tabelle 8:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 3-Cl; V² = H.

- Tabelle 9:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 3-Cl; V² = H.
- 5 **Tabelle 10:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 2-Cl; V² = 4-Cl.
- Tabelle 11:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 2-Cl; V² = 4-Cl.
- 10 **Tabelle 12:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 2-Cl; V² = 4-Cl.
- Tabelle 13:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 4-CF₃; V² = H.
- 15 **Tabelle 14:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-CF₃; V² = H.
- Tabelle 15:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-CF₃; V² = H.
- 20 **Tabelle 16:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 4-CH₃; V² = H.
- Tabelle 17:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-CH₃; V² = H.
- 25 **Tabelle 18:** A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-CH₃; V² = H.

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

W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 4-OCH₃; V² = H.

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

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-OCH₃; V² = H.

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

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-OCH₃; V² = H.

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

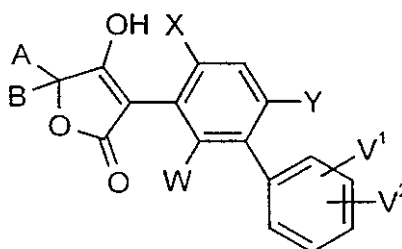

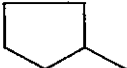
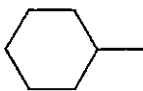


Tabelle 22: W = H; X = CH₃, Y = H, V¹ = H, V² = H.

10

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

Fortsetzung Tabelle 22:

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

Fortsetzung Tabelle 22:

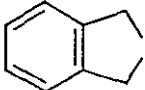
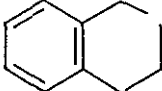
A	B
	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$
	$(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$
	$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$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

Tabelle 23: A und B wie in Tabelle 22 angegebenW = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

Tabelle 24: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = \text{CH}_3$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}_3$; $V^1 = \text{H}$; $V^2 = \text{H}$.

Tabelle 25: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

5

$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{H}$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

Tabelle 26: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

10

Tabelle 27: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = \text{CH}_3$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

Tabelle 28: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{H}$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

15

Tabelle 29: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}_3$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

Tabelle 30: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

20

$W = \text{CH}_3$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}_3$; $V^1 = 3\text{-Cl}$; $V^2 = \text{H}$.

Tabelle 31: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = \text{H}$, $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{H}$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.

25

Tabelle 32: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.

Tabelle 33: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = \text{CH}_3$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}_3$; $V^1 = 4\text{-CF}_3$; $V^2 = \text{H}$.

30

Tabelle 34: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = H; X = CH_3; Y = H; V^1 = 2-Cl; V^2 = 4-Cl.$

Tabelle 35: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

5 $W = H; X = CH_3; Y = CH_3; V^1 = 2-Cl; V^2 = 4-Cl.$

Tabelle 36: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = CH_3; X = CH_3; Z = CH_3; V^1 = 2-Cl; V^2 = 4-Cl.$

10 **Tabelle 37:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = H; X = CH_3; Y = H; V^1 = 4-CH_3; V^2 = H.$

Tabelle 38: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = H; X = CH_3; Y = CH_3; V^1 = 4-CH_3; V^2 = H.$

15

Tabelle 39: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = CH_3; X = CH_3; Y = CH_3; V^1 = 4-CH_3; V^2 = H.$

Tabelle 40: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

20 $W = H; X = CH_3; Y = H; V^1 = 4-OCH_3; V^2 = H.$

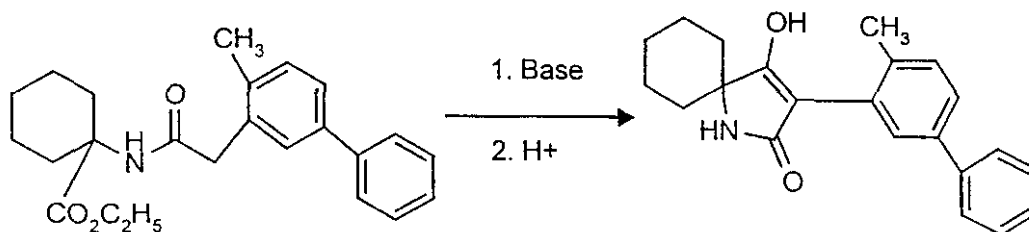
Tabelle 41: A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = H; X = CH_3; Y = CH_3; V^1 = 4-OCH_3; V^2 = H.$

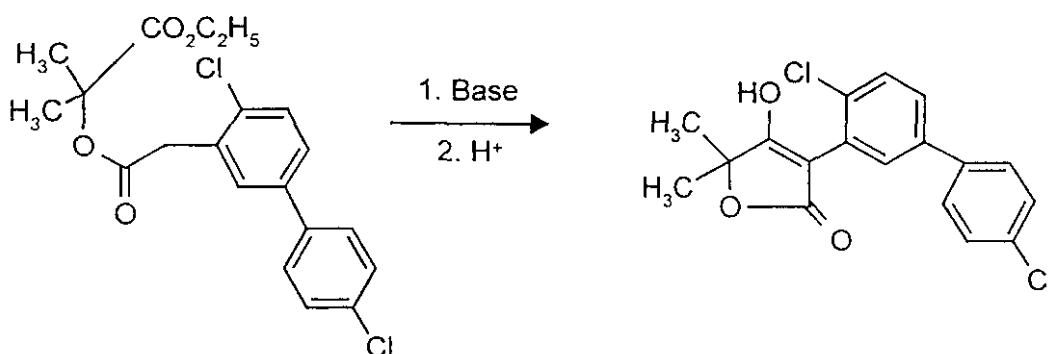
25 **Tabelle 42:** A und B wie in Tabelle 22 angegeben

$W = CH_3; X = CH_3; Y = CH_3; V^1 = 4-OCH_3; V^2 = H.$

30 Verwendet man gemäß Verfahren (A) N-[(6-Methyl-3-phenyl)-phenylacetyl]-1-amino-cyclohexan-carbonsäureethylester als Ausgangsstoff, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



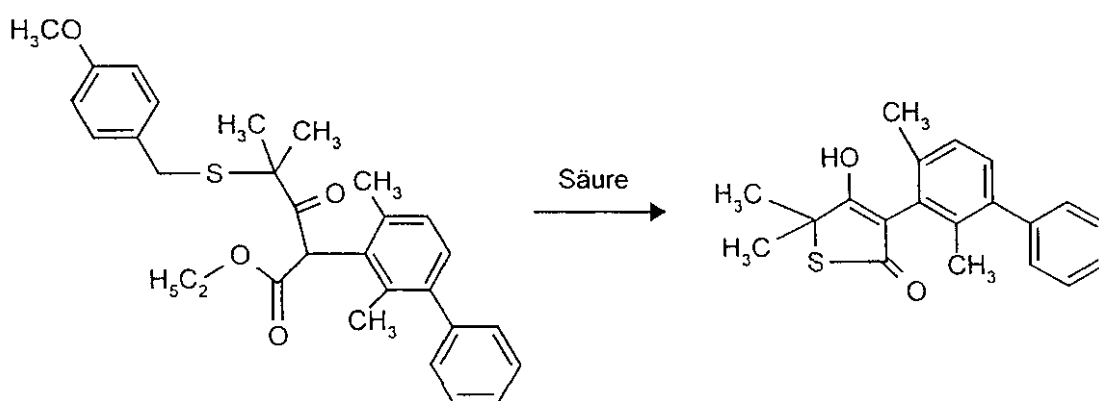
Verwendet man gemäß Verfahren (B) O-[(2-Chlor-5-(4-chlor)-phenyl)-phenylacetyl]-2-hydroxyisobuttersäureethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



5

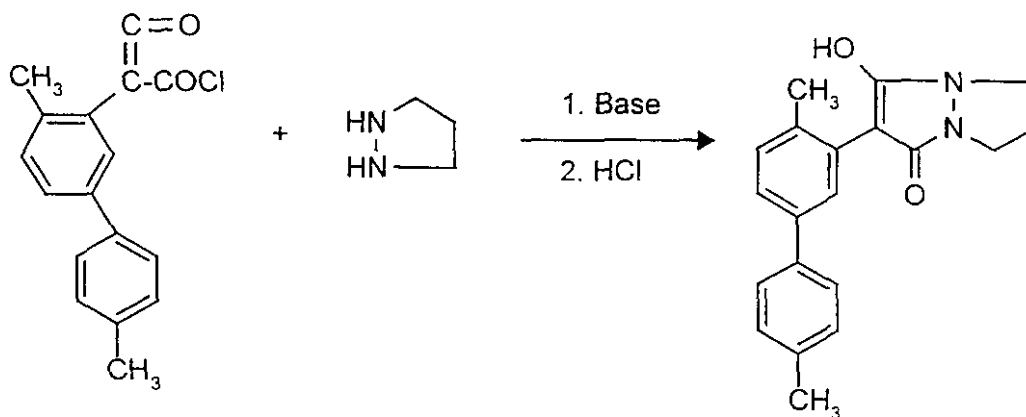
Verwendet man gemäß Verfahren (C) 2-[(2,6-Dimethyl-3-phenyl)-phenyl]-4-(4-methoxy)-benzylmercapto-4-methyl-3-oxo-valeriansäure-ethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

10

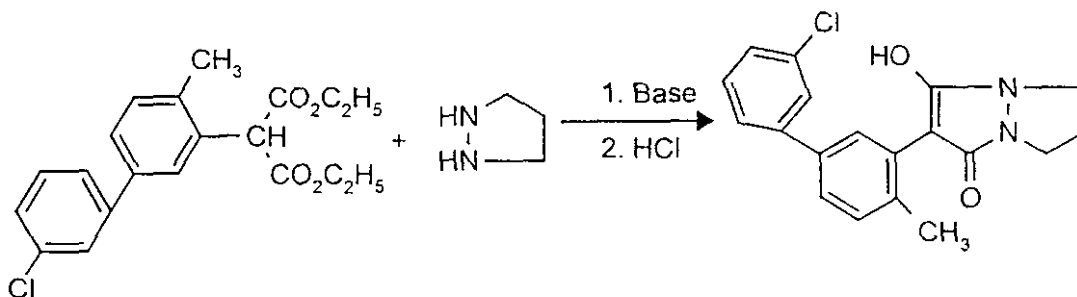


Verwendet man beispielsweise gemäß Verfahren (D-α) (Chlorcarbonyl)-3-[(6-methyl-3-(4-methyl)-phenyl)-phenyl]-keten und 1,2-Diazacyclopentan als Aus-

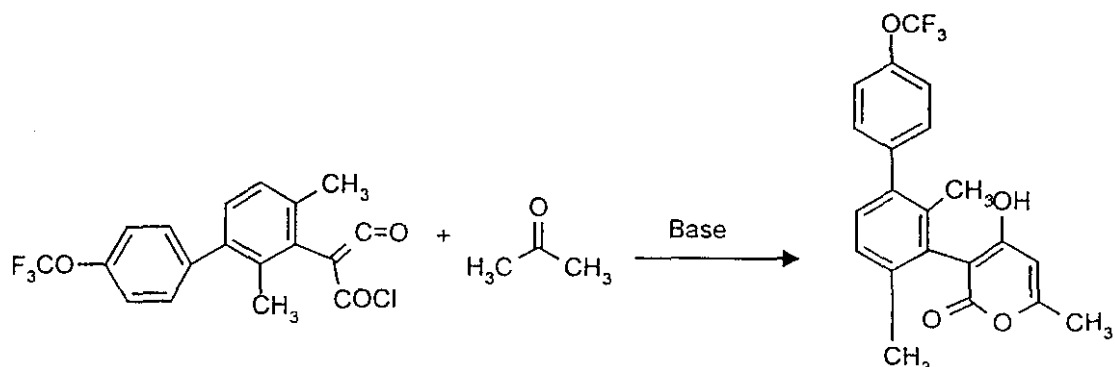
gangsverbindungen, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



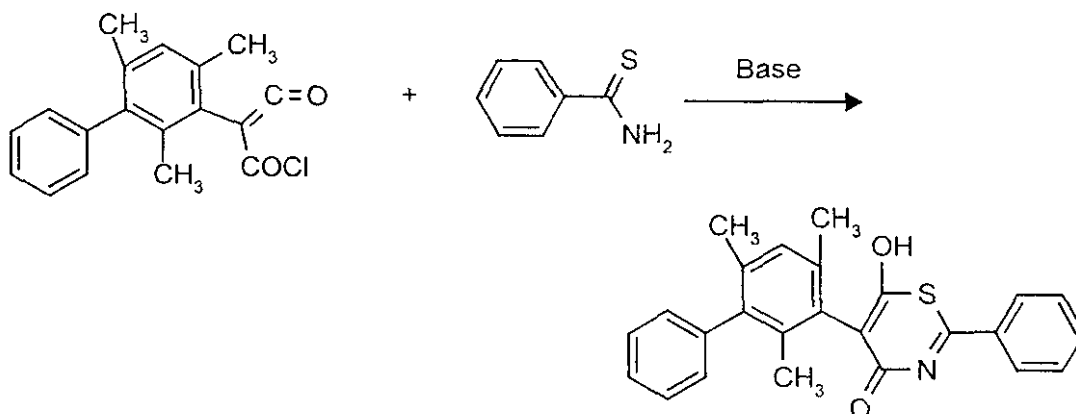
- 5 Verwendet man beispielsweise gemäß Verfahren (D-β) 3-[6-Methyl-3-(3-chlor-phenyl)]-phenylmalonsäurediethylester und 1,2-Diazacyclopentan als Ausgangsverbindungen, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch das folgende Reaktionsschema wiedergegeben werden:



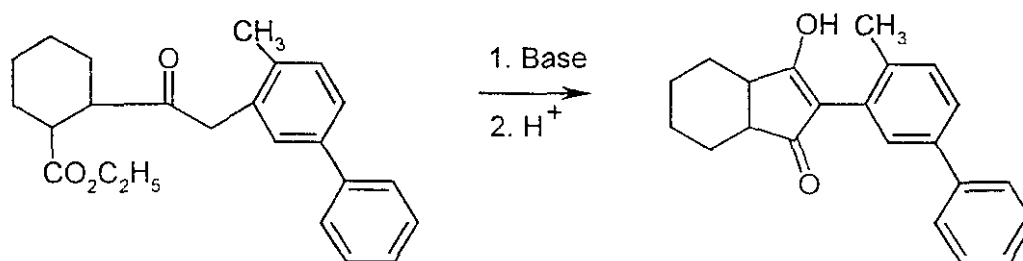
- 10 Verwendet man beispielsweise gemäß Verfahren (E) (Chlorcarbonyl)-2-[(2,6-dimethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl))-phenyl]-keten und Aceton als Ausgangsverbindungen, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch das folgende Reaktionsschema wiedergegeben werden:



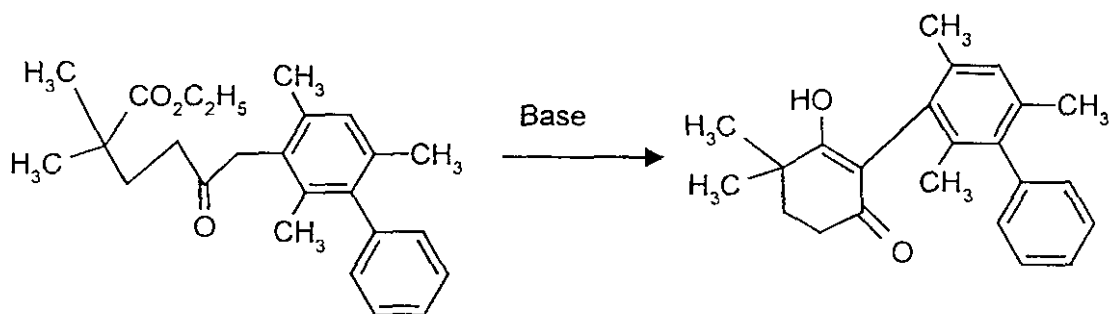
Verwendet man beispielsweise gemäß Verfahren (F) (Chlorcarbonyl)-2-[(2,4,6-Tri-
methyl-3-phenyl)-phenyl]-keten und Thiobenzamid als Ausgangsverbindungen, so
5 kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch das folgende Reaktions-
schema wiedergegeben werden:



Verwendet man gemäß Verfahren (G) 5-[(6-Methyl-3-phenyl)-phenyl]-2,3-tetra-
methylen-4-oxo-valeriansäureethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen
10 Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

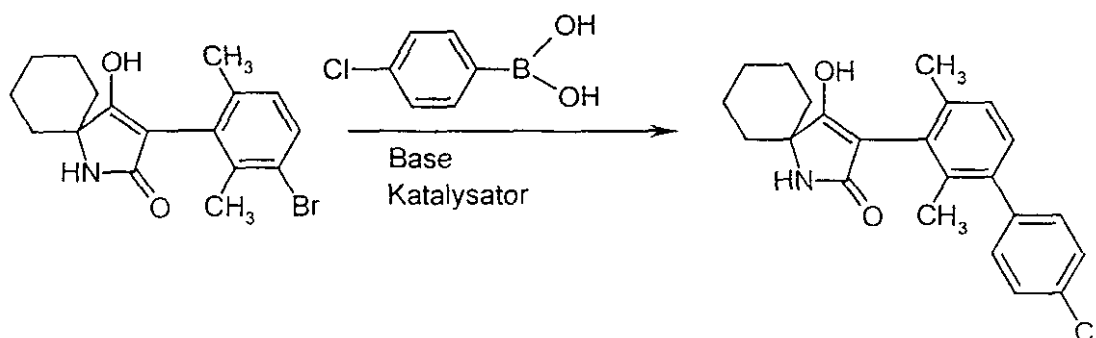


Verwendet man gemäß Verfahren (H) 5-[(2,4,6-Trimethyl-3-phenyl)-phenyl]-2,2-dimethyl-5-oxo-hexansäure-ethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



5

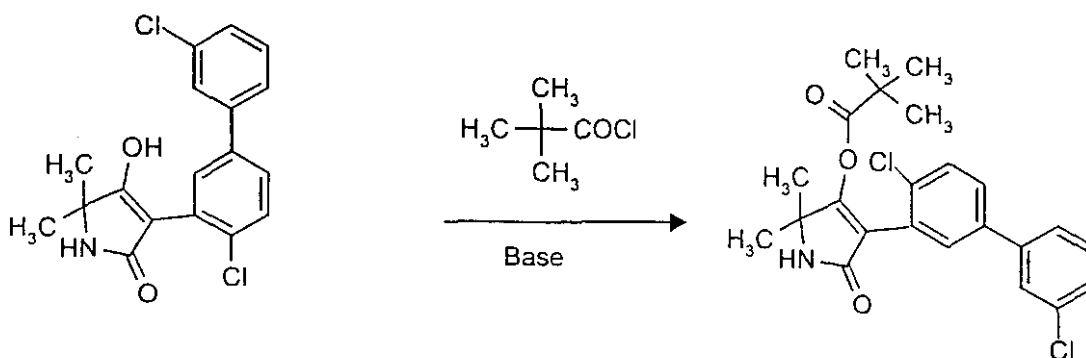
Verwendet man gemäß Verfahren (I) 3-[(2,6-Dimethyl-3-brom)-phenyl]-4,4-(penta-methylen)-pyrrolidin-2,4-dion und 4-Chlorphenylboronsäure als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Schema wiedergegeben werden:



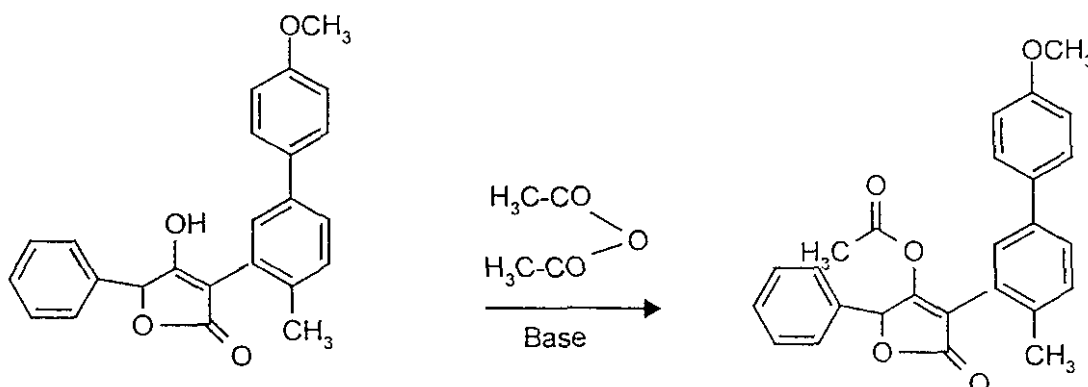
10

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

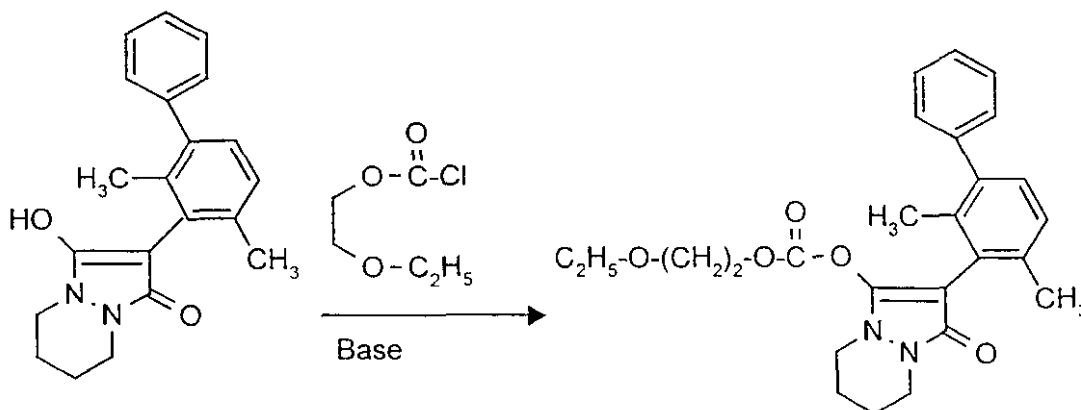
15



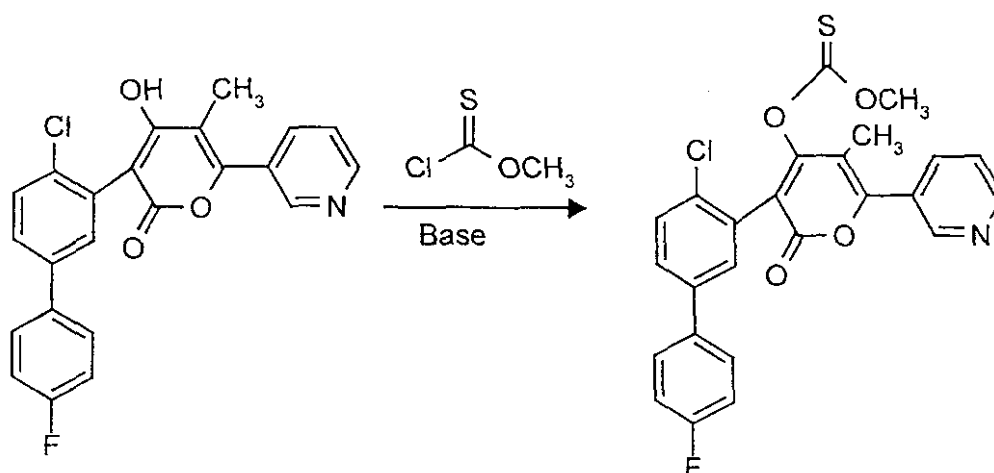
Verwendet man gemäß Verfahren (J) (Variante β) 3-[(6-Methyl-3-(4-methoxy-phenyl))-phenyl]-4-hydroxy-5-phenyl- Δ^3 -dihydrofuran-2-on und Acetanhydrid als Ausgangsverbindungen, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



Verwendet man gemäß Verfahren (K) 8-[(2,6-Dimethyl-3-phenyl)-phenyl]-1,6-diazabicyclo-(4,3,0^{1,6})-nonan-7,9-dion und Chlorameisensäureethoxyethylester als Ausgangsverbindungen, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

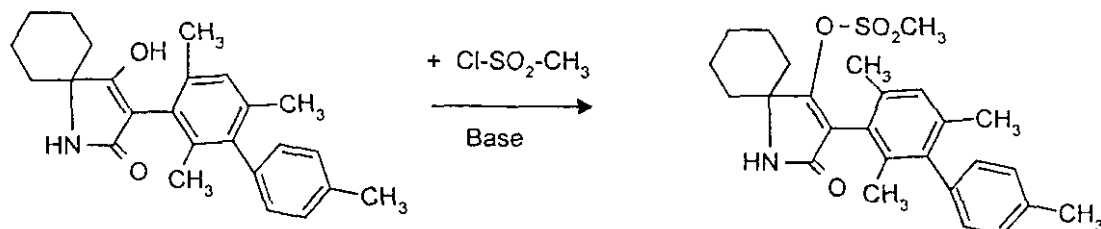


Verwendet man gemäß Verfahren (L), 3-[(2-Chlor-5-(4-fluor-phenyl))-phenyl]-4-hydroxy-5-methyl-6-(3-pyridyl)-pyron und Chlormonothioameisensäuremethylester als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf folgendermaßen wiedergegeben werden:



5

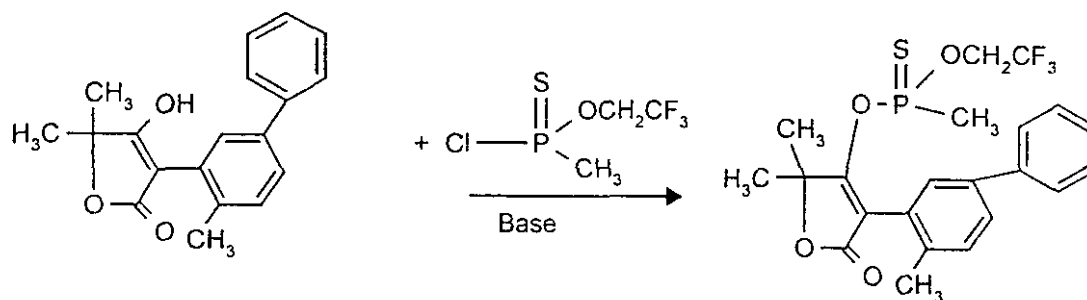
Verwendet man gemäß Verfahren (M) 2-[(2,4,6-Trimethyl-3-(4-methyl-phenyl))-phenyl]-5,5-pentamethylen-pyrrolidin-2,4-dion und Methansulfonsäurechlorid als Ausgangsprodukt, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



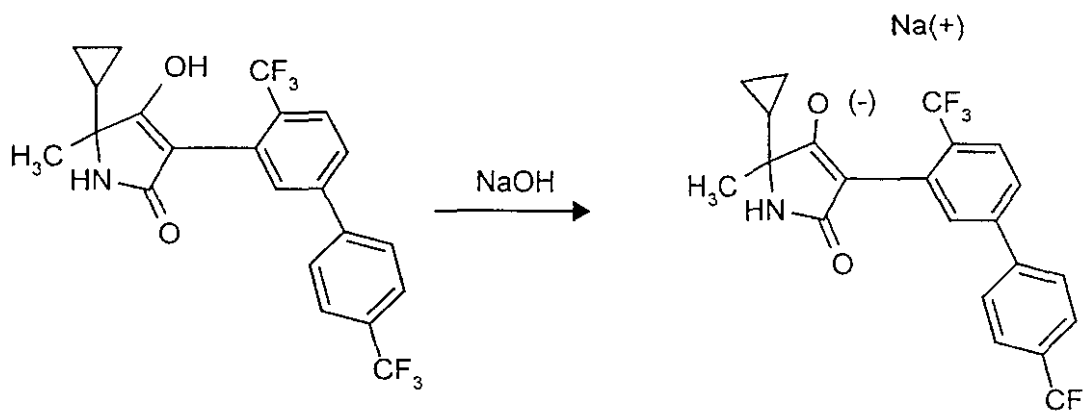
10

Verwendet man gemäß Verfahren (N) 2-[(6-Methyl-3-phenyl)-phenyl]-4-hydroxy-5,5-dimethyl-Δ³-dihydrofuran-2-on und Methanthio-phosphonsäurechlorid-(2,2,2-trifluorethylester) als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

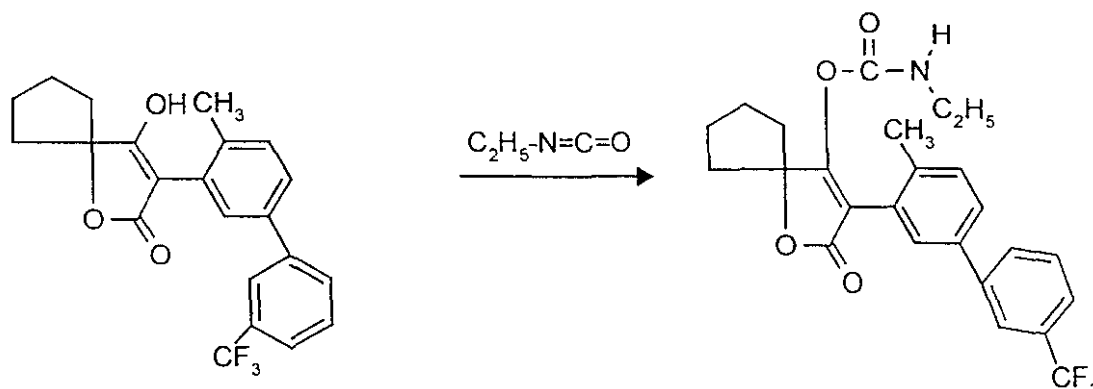
15



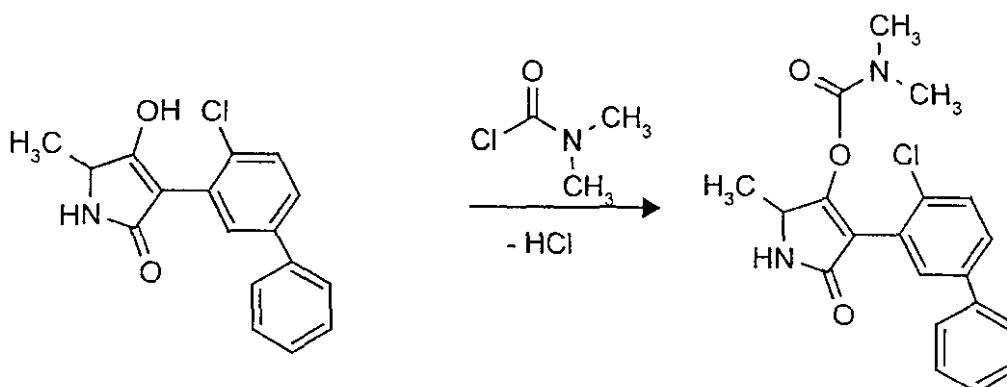
Verwendet man gemäß Verfahren (O) 3-[(2-Trifluormethyl-5-(4-trifluormethyl-phenyl))-phenyl]-5-cyclopropyl-5-methyl-pyrrolidin-2,4-dion und NaOH als Komponenten, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



Verwendet man gemäß Verfahren (P) (Variante α) 3-[(6-Methyl-6-(3-trifluormethyl-phenyl))-phenyl]-4-hydroxy-5-tetramethylen- Δ^3 -dihydro-furan-2-on und Ethylisocyanat als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

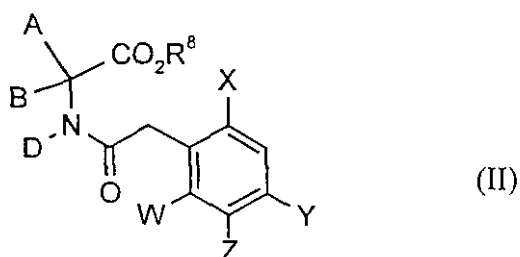


Verwendet man gemäß Verfahren (P) (Variante β) 3-[(2-Chlor-5-phenyl)-phenyl]-5-methyl-pyrrolidin-2,4-dion und Dimethylcarbamidsäurechlorid als Ausgangsprodukte, so kann der Reaktionsverlauf durch folgendes Schema wiedergegeben werden:



5

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



in welcher

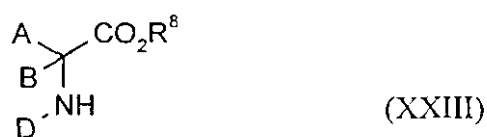
10

A, B, D, W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

sind neu.

15

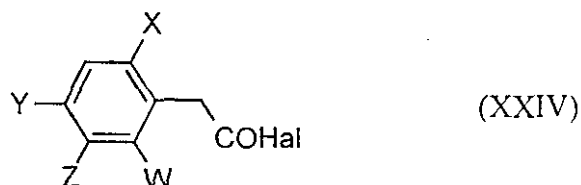
Man erhält die Acylaminosäureester der Formel (II) beispielsweise, wenn man Aminosäurederivate der Formel (XXIII)



in welcher

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

5 mit substituierten Phenylelessigsäurehalogeniden der Formel (XXIV)



in welcher

W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und

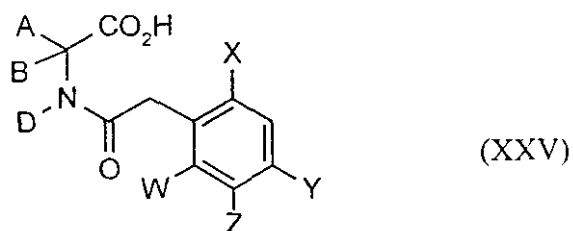
10

Hal für Chlor oder Brom steht,

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

15

oder wenn man Acylaminosäuren der Formel (XXV)

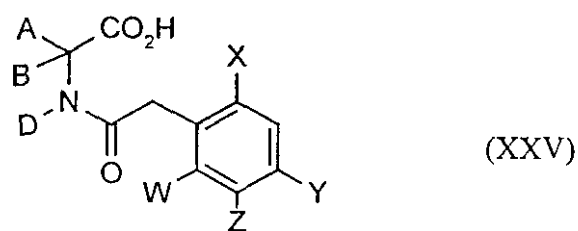


in welcher

20 A, B, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

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

Die Verbindungen der Formel (XXV)



in welcher

A, B, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

sind neu.

Man erhält die Verbindungen der Formel (XXV), wenn man Aminosäuren der Formel (XXVI)

10

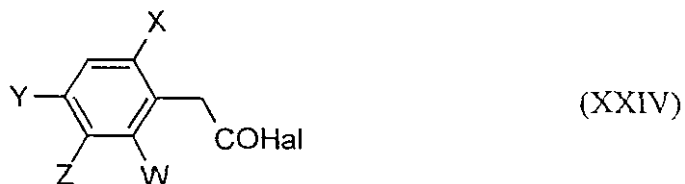


in welcher

A, B und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

mit substituierten Phenyllessigsäurehalogeniden der Formel (XXIV)



in welcher

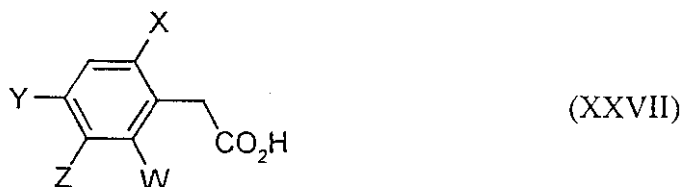
20 W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Chlor oder Brom steht,

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

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

10 Man erhält die Verbindungen der Formel (XXIV) beispielsweise, indem man substituierte Phenylessigsäuren der Formel (XXVII)



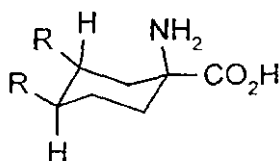
in welcher

- 15 W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,
- mit Halogenierungsmitteln (z.B. Thionylchlorid, Thionylbromid, Oxalylchlorid, Phosgen, Phosphortrichlorid, Phosphortribromid oder Phosphorpentachlorid) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. gegebenenfalls chlorierten aliphatischen oder aromatischen Kohlenwasserstoffen wie Toluol oder Methylenchlorid) bei Temperaturen von -20°C bis 150°C, bevorzugt von -10°C bis 100°C,
- 20 umsetzt.

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

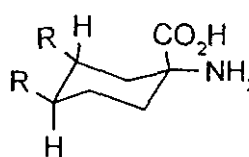
Die substituierten cyclischen Aminocarbonsäuren der Formel (XXVIa), in der A und B einen Ring bilden, sind im allgemeinen nach der Bucherer-Bergs-Synthese oder

- nach der Strecker-Synthese erhältlich und fallen dabei jeweils in unterschiedlichen Isomerenformen an. So erhält man unter den Bedingungen der Bucherer-Bergs-Synthese vorwiegend die Isomeren (im folgenden der Einfachheit halber als β bezeichnet), in welchen die Reste R und die Carboxylgruppe äquatorial stehen, während nach den Bedingungen der Strecker-Synthese vorwiegend die Isomeren (im folgenden der Einfachheit halber als α bezeichnet) anfallen, bei denen die Amino-
- 5 während nach den Bedingungen der Strecker-Synthese vorwiegend die Isomeren (im folgenden der Einfachheit halber als α bezeichnet) anfallen, bei denen die Amino-
- gruppe und die Reste R äquatorial stehen.



Bucherer-Bergs-Synthese

(β-Isomeres)



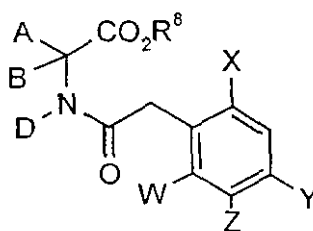
Strecker-Synthese

(α-Isomeres)

10

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

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



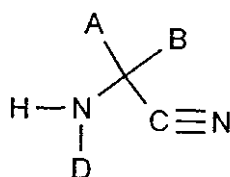
(II)

in welcher

20

A, B, D, W, X, Y, Z und R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

herstellen, indem man Aminonitrile der Formel (XXVIII)



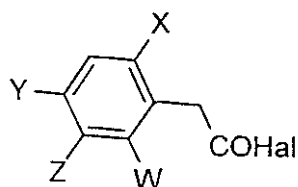
(XXVIII)

in welcher

A, B und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit substituierten Phenyllessigsäurehalogeniden der Formel (XXIV)



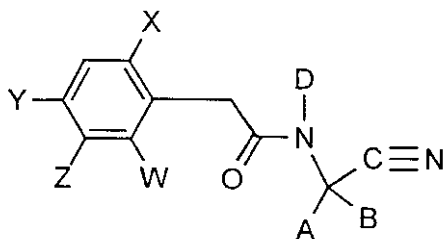
(XXIV)

in welcher

10

W, X, Y, Z und Hal die oben angegebenen Bedeutungen haben,

zu Verbindungen der Formel (XXIX)



(XXIX)

15

in welcher

A, B, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

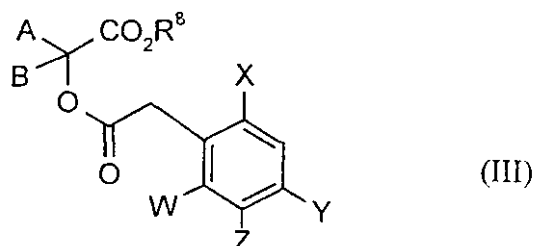
umsetzt,

20

und diese anschließend einer sauren Alkoholyse unterwirft.

Die Verbindungen der Formel (XXIX) sind ebenfalls neu.

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



in welcher

A, B, W, X, Y, Z und R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben,
10 sind neu.

Sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen.

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

2-Hydroxycarbonsäureester der Formel (XXX)

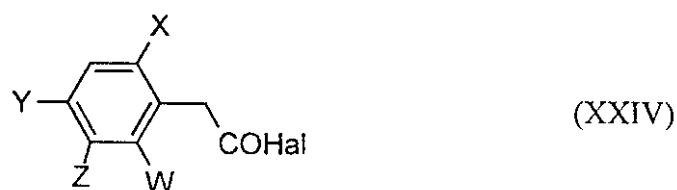


20 in welcher

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

mit substituierten Phenylelessigsäurehalogeniden der Formel (XXIV)

25



in welcher

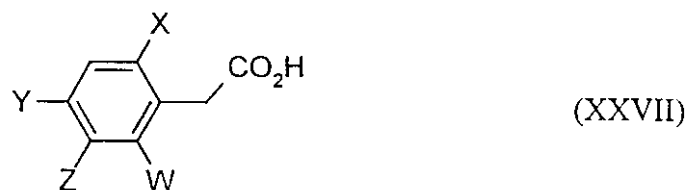
W, X, Y, Z und Hal die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

acyliert (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953) und eingangs zitierte Anmeldungen).

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

10 substituierte Phenylelessigsäuren der Formel (XXVII)



in welcher

15 W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit α -Halogen-carbonsäureestern der Formel (XXXI)



20 in welcher

A, B und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Chlor oder Brom steht,

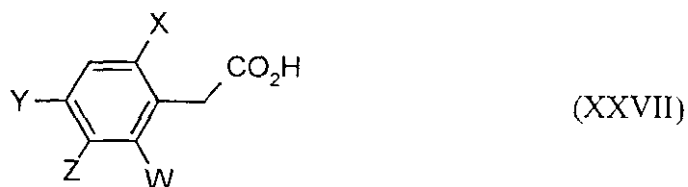
alkyliert.

5 Die Verbindungen der Formel (XXVII) sind neu.

Die Verbindungen der Formel (XXXI) sind käuflich.

Beispielsweise erhält man die Verbindungen der Formel (XXVII),

10

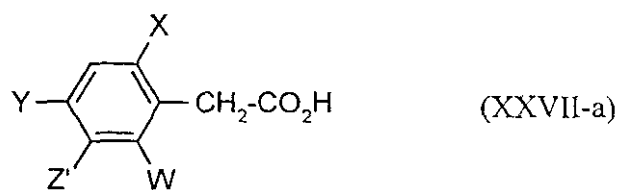


in welcher

W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

α) wenn man Verbindungen der Formel (XXVII-a)



in welcher

20

X und Y die oben angegebene Bedeutung haben,

Z' für Chlor oder Brom, bevorzugt für Brom steht,

25 mit Boronsäuren der Formel (XII)



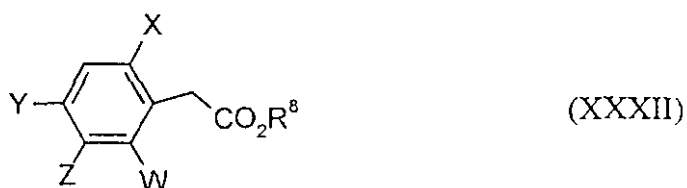
in welcher

5 Z die oben angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Lösungsmittels, einer Base und eines Katalysators (bevorzugt eines Palladiumkomplexes, wie z.B. Palladium-tetrakis(triphenylphosphin)) umgesetzt oder

10

β) wenn man Phenylelessigsäureester der Formel (XXXII)



in welcher

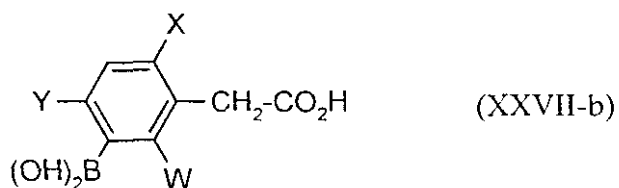
15

W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

in Gegenwart von Säuren oder Basen, in Gegenwart eines Lösungsmittels unter allgemein bekannten Standardbedingungen verseift oder

20

γ) wenn man Phenylelessigsäuren der Formel (XXVII-b)



in welcher

W, X und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Halogenverbindungen der Formel (XXXIII),

5



in welcher

10

Z die oben angegebene Bedeutung hat und

Hal für Chlor, Brom oder Iod, bevorzugt für Brom und Iod steht,

in Gegenwart eines Lösungsmittels, einer Base und eines Katalysators (be-

15

vorzugt eines der oben genannten Palladiumkomplexe) umgesetzt.

Die Verbindungen der Formeln (XII) und (XXXIII) sind teilweise bekannt, teilweise käuflich oder lassen sich nach im Prinzip bekannten Verfahren herstellen. Die Phenyllessigsäuren der Formel (XXVII-a) sind teilweise aus WO 97/01 535, WO

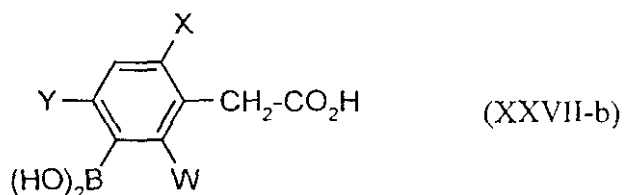
20

97/36 868 und WO 98/05 638 bekannt oder lassen sich nach den dort beschriebenen Verfahren herstellen.

Die Verbindungen der Formeln (XXVII-b) und (XXXII) sind neu.

25

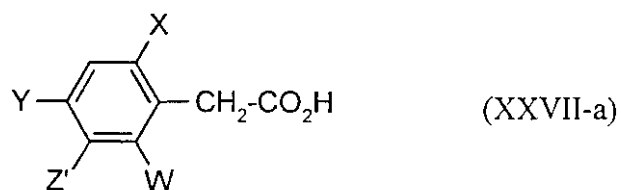
Man erhält die Verbindungen der Formel (XXVII-b)



in welcher

W, X und Y die oben angegebene Bedeutung haben,

5 beispielsweise, wenn man Phenyllessigsäuren der Formel (XXVII-a)



in welcher

10 W, X, Y und Z' die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Lithiumverbindungen der Formel (XXXIV)



15

in welcher

R^{21} für C_1 - C_8 -Alkyl oder Phenyl, bevorzugt für $\text{n-C}_4\text{H}_9$ steht,

20 und Boronsäureestern der Formel (XXXV)



in welcher

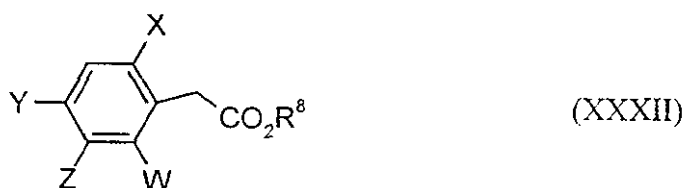
25

R^8 die oben angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

Die Verbindungen der Formeln (XXXIV) und (XXXV) sind käufliche Verbindungen.

5 Die Verbindungen der Formel (XXXII)



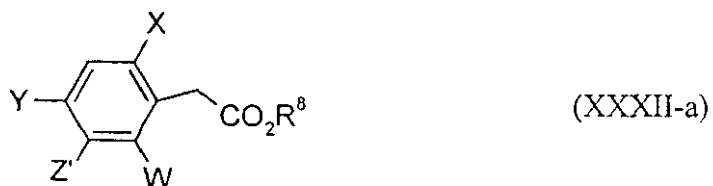
in welcher

10 W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

erhält man beispielsweise,

wenn man Phenyllessigsäureester der Formel (XXXII-a)

15



in welcher

R⁸, W, X, Y und Z' die oben angegebene Bedeutung haben.

20

mit Boronsäuren der Formel (XII)



in welcher

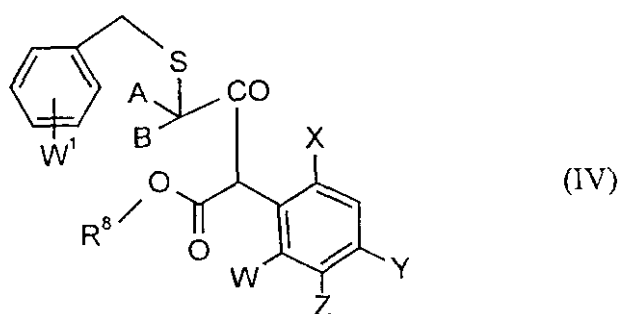
Z die oben angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Lösungsmittels, einer Base und eines Katalysators (bevorzugt
5 eines der oben genannten Palladiumkomplexe) umsetzt.

Die Phenyllessigsäureester der Formel (XXXII-a) sind teilweise aus den An-
meldungen WO 97/01535, WO 97/36868 und WO 98/0563 bekannt oder lassen sich
nach den dort beschriebenen Verfahren herstellen.

10

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



15 in welcher

A, B, W, W¹, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

sind neu.

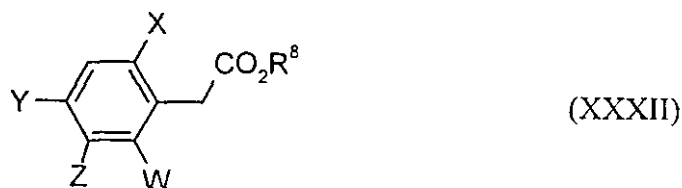
20

Sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen.

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

25

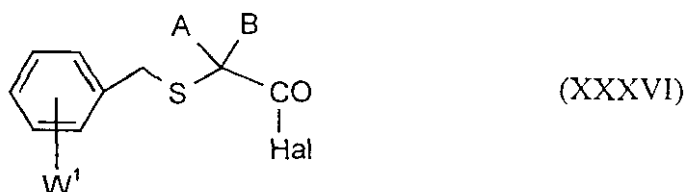
substituierte Phenyllessigsäureester der Formel (XXXII)



in welcher

5 W, X, Y, R⁸ und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit 2-Benzylthio-carbonsäurehalogeniden der Formel (XXXVI)



10 in welcher

A, B und W¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

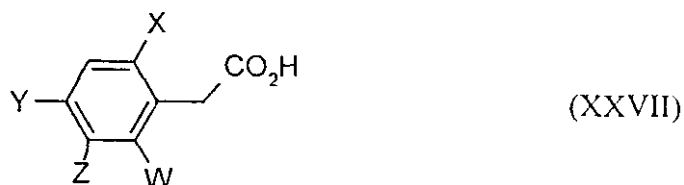
Hal für Halogen (insbesondere Chlor oder Brom) steht,

15

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

20

Die Verbindungen der Formel (XXXII) sind neu. Man erhält Verbindungen der Formel (XXXII) auch wenn man Verbindungen der Formel (XXVII)



in welcher

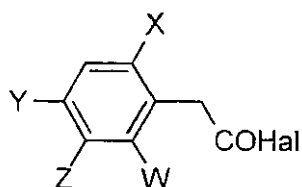
W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

5

in Gegenwart von Alkoholen und wasserentziehenden Mitteln (z.B. konz. Schwefelsäure) verestert,

oder Alkohole mit Verbindungen der Formel (XXIV)

10



(XXVI)

in welcher

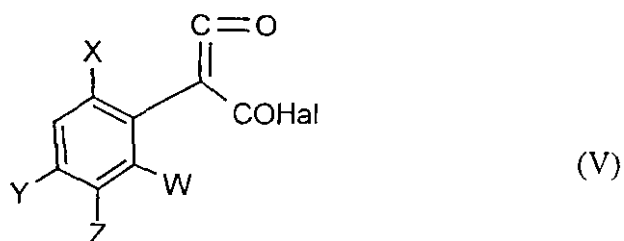
W, X, Y, Z und Hal die oben angegebenen Bedeutungen haben

15

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

Die Benzylthio-carbonsäurehalogenide der Formel (XXXVI) sind teilweise bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (J. Antibiotics (1983), 26,
20 1589).

Die bei den obigen Verfahren (D), (E) und (F) als Ausgangsstoffe benötigten Halogencarbonylketene der Formel (V) sind neu. Sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden in einfacher Weise herstellen (vgl. beispielsweise Org. Prep.
25 Proced. Int., 7, (4), 155-158, 1975 und DE 1 945 703). So erhält man z.B. die Verbindungen der Formel (V)



in welcher

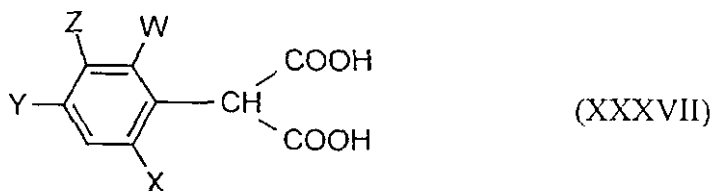
W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5

Hal für Chlor oder Brom steht,

wenn man

10 substituierte Phenylmalonsäuren der Formel (XXXVII)



in welcher

15 W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Säurehalogeniden, wie beispielsweise Thionylchlorid, Phosphor(V)chlorid, Phosphor(III)chlorid, Oxalylchlorid, Phosgen oder Thionylbromid gegebenenfalls in Gegenwart von Katalysatoren, wie beispielsweise Dimethylformamid, Methyl-Sterylformamid oder Triphenylphosphin und gegebenenfalls in Gegenwart von Basen wie

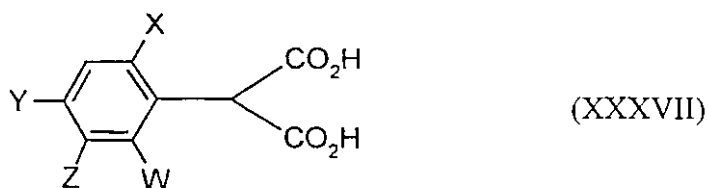
20 z.B. Pyridin oder Triethylamin, umgesetzt.

Die substituierten Phenylmalonsäuren der Formel (XXXVII) sind neu. Sie lassen sich in einfacher Weise nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. z.B. Organikum,

VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, S. 517 ff, EP-A-528 156, WO 97/36868, WO 97/01535 und WO 98/05638).

So erhält man Phenylmalonsäuren der Formel (XXXVII)

5

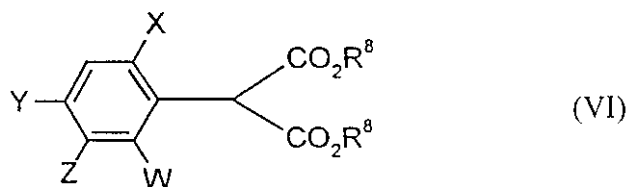


in welcher

W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

wenn man Phenylmalonsäureester der Formel (VI)



in welcher

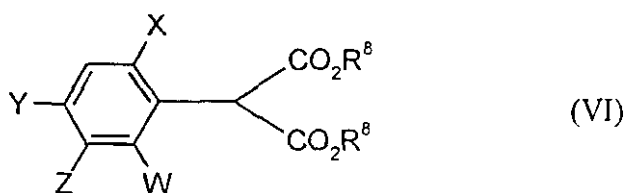
15

W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

zunächst in Gegenwart einer Base und einem Lösungsmittel verseift und anschließend vorsichtig ansäuert (EP-528 156, WO 97/36868, WO 97/01535).

20

Die Malonsäureester der Formel (VI)



in welcher

W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

5

sind neu.

Sie lassen sich nach allgemein bekannten Methoden der Organischen Chemie darstellen (vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 27, 2763 (1986) und Organikum VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, S. 587 ff.).

10

Die für das erfindungsgemäße Verfahren (D) als Ausgangsstoffe benötigten Hydrazine der Formel (VII)

15



in welcher

A und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

sind teilweise bekannt und/oder nach literaturbekannten Methoden herstellbar (vgl. beispielsweise Liebigs Ann. Chem. 585, 6 (1954); Reaktionen der organischen Synthese, C. Ferri, Seite 212, 513; Georg Thieme Verlag Stuttgart, 1978; Liebigs Ann. Chem. 443, 242 (1925); Chem. Ber. 98, 2551 (1965), EP-508 126).

25

Die für das erfindungsgemäße Verfahren (E) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonylverbindungen der Formel (VIII)



in welcher

A und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

oder deren Silylenolether der Formel (VIIIa)



in welcher

10

A, D und R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

sind käufliche, allgemeine bekannte oder nach bekannten Verfahren zugängliche Verbindungen.

15

Die Herstellung der zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) als Ausgangsstoffe benötigten Ketensäurechloride der Formel (V) wurde bereits oben beschrieben. Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) benötigten Thioamide der Formel (IX)

20



in welcher

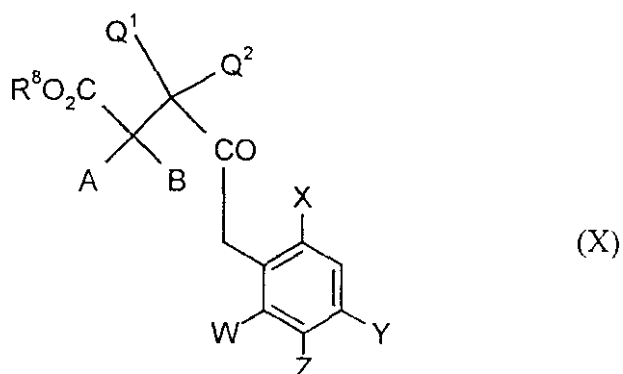
A die oben angegebene Bedeutung hat,

25

sind allgemein in der Organischen Chemie bekannte Verbindungen.

Die bei dem obigen Verfahren (G) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (X)

5



in welcher

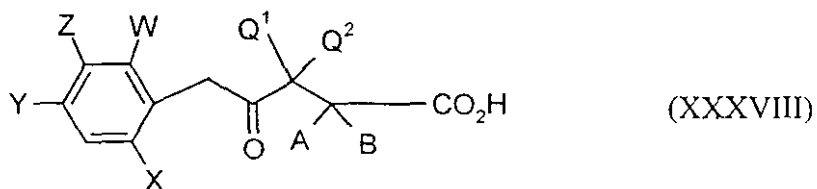
A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

10

sind neu.

Sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen.

15 Man erhält die Verbindungen der Formel (X) beispielsweise, wenn man Verbindungen der Formel (XXXVIII)



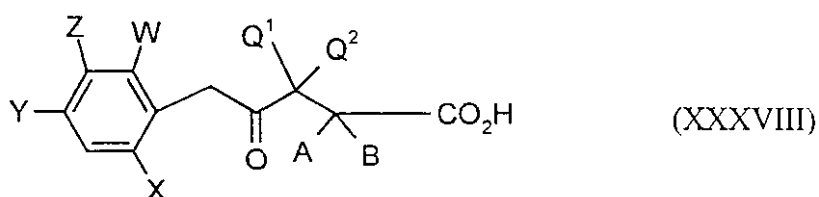
in welcher

20

W, X, Y, Z, A, B, Q¹ und Q² die oben angegebene Bedeutung haben,

verestert (vgl. z.B. Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, Seite 499) oder alkyliert (siehe Herstellungsbeispiel).

- 5 Die Verbindungen der Formel (XXXVIII)

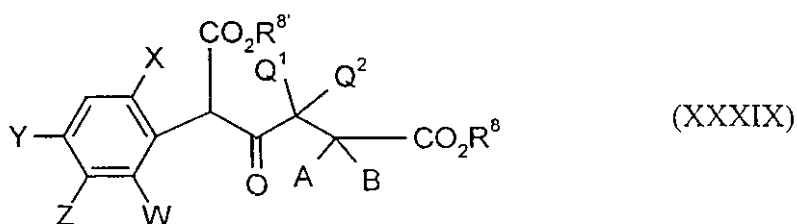


in welcher

- 10 A, B, Q¹, Q², W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

sind neu, lassen sich aber nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen (siehe Herstellungsbeispiel).

- 15 Man erhält die 5-Aryl-4-ketocarbonsäuren der Formel (XXXVIII) beispielsweise, wenn man 2-Phenyl-3-oxo-adipinsäureester der Formel (XXXIX)



in welcher

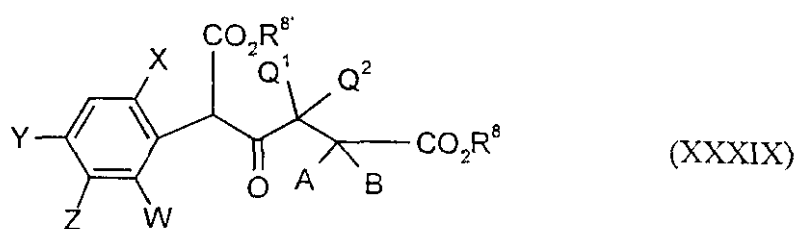
20

A, B, D¹, D², W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

R⁸ und R^{8'} für Alkyl (insbesondere C₁-C₈-Alkyl) stehen,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base oder Säure decarboxyliert (vgl. z.B. Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, Seite 519 bis 521).

- 5 Die Verbindungen der Formel (XXXIX)



in welcher

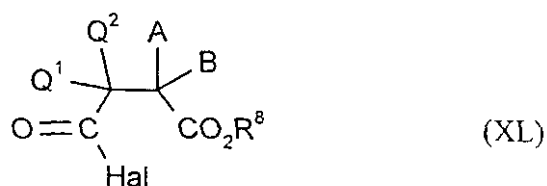
- 10 A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R⁸, R^{8'} die oben angegebene Bedeutung haben,

sind neu.

Man erhält die Verbindungen der Formel (XXXIX) beispielsweise,

15

wenn man Dicarbonsäurehalbesterchloride der Formel (XL),



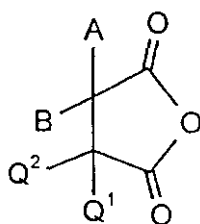
in welcher

20

A, B, Q¹, Q² und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben und

Hal für Chlor oder Brom steht,

oder Carbonsäureanhydride der Formel (XLI-A)

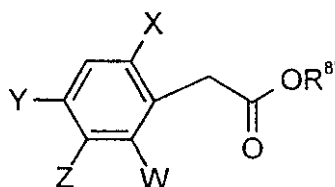


(XLI-A)

in welcher

5 A, B, Q¹ und Q² die oben angegebene Bedeutung haben,

mit einem Phenyllessigsäureester der Formel (XXXII)



(XXXII)

10 in welcher

W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

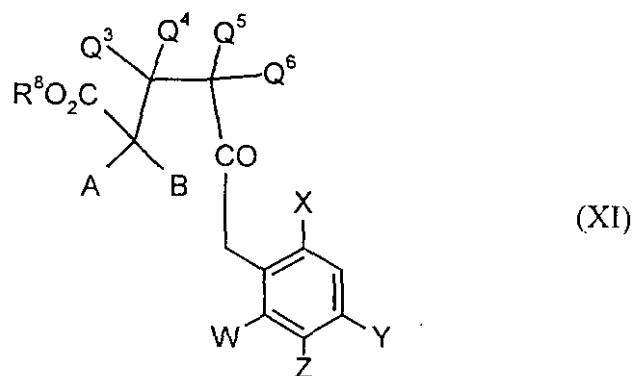
in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base acyliert (vgl.

15 z.B. M.S. Chambers, E. J. Thomas, D.J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, vgl. auch die Herstellungsbeispiele).

Die Verbindungen der Formeln (XL) und (XLI-A) sind teilweise bekannte oder käufliche Verbindungen der Organischen Chemie und/oder lassen sich nach im Prinzip

20 bekannten Methoden in einfacher Weise herstellen.

Die bei dem obigen Verfahren (H) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (XI)



in welcher

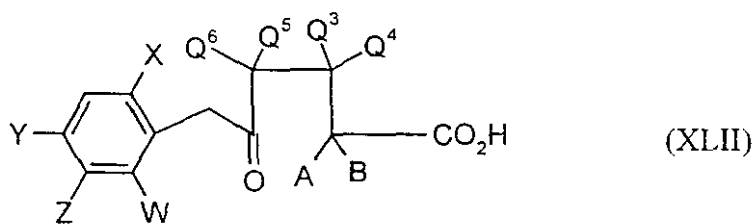
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

5

sind neu.

Sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen.

- 10 Man erhält die 6-Aryl-5-ketocarbonsäureester der Formel (XI) beispielsweise, wenn man 6-Aryl-5-ketocarbonsäuren der Formel (XLII)



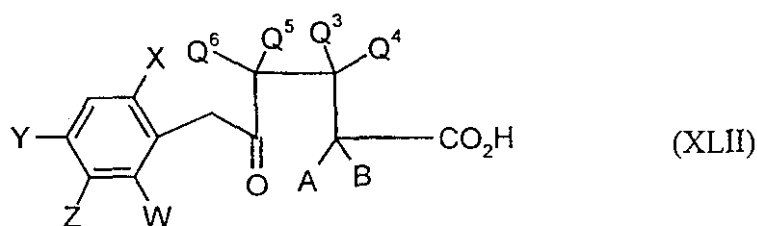
in welcher

15

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

verestert, (vgl. z.B. Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, Seite 499).

- 20 Die Verbindungen der Formel (XLII)



in welcher

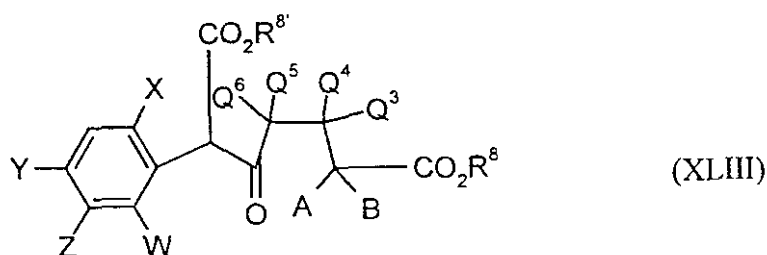
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

5

sind neu. Sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden herstellen, beispielsweise wenn man

substituierte 2-Phenyl-3-oxo-heptandisäureester der Formel (XLIII)

10



in welcher

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

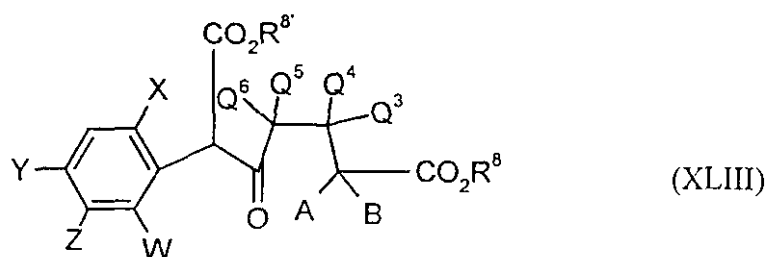
15

R⁸ und R^{8'} für Alkyl (bevorzugt C₁-C₆-Alkyl), stehen,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base oder Säure verseift und decarboxyliert (vgl. z.B. Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, Seite 519 bis 521) (siehe auch Herstellungsbeispiel).

20

Die Verbindungen der Formel (XLIII)

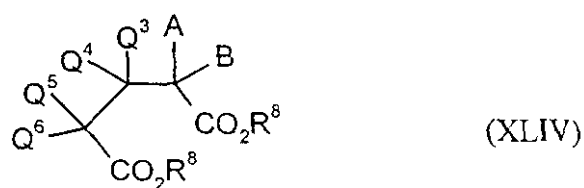


in welcher

5 A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R⁸ und R^{8'} die oben angegebene Bedeutung haben,

sind neu. Man erhält sie beispielsweise

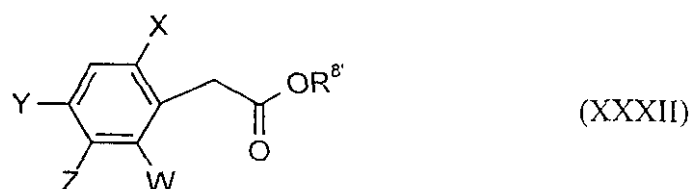
10 wenn man Dicarbonsäureester der Formel (XLIV),



in welcher

15 A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶ und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben,

mit einem substituierten Phenylessigsäureester der Formel (XXXII)



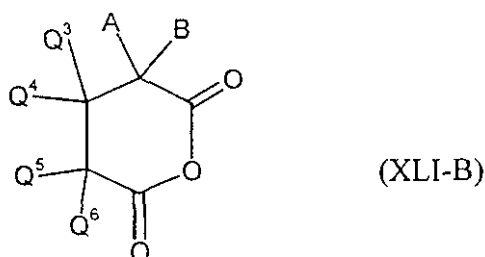
in welcher

20 W, X, Y, Z und R^{8'} die oben angegebene Bedeutung haben,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base kondensiert (siehe auch Herstellungsbeispiel).

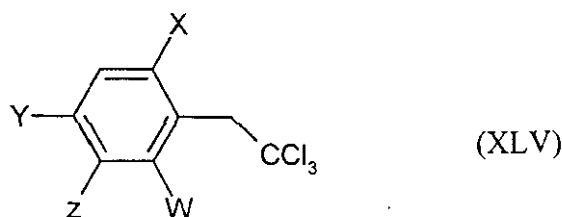
Die Verbindungen der Formel (XLIV) sind teilweise bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren darstellen.

Anstelle der Verbindungen der Formel (XLIV) lassen sich auch die entsprechenden Anhydride einsetzen. Man verfährt dann wie bei der Herstellung der Verbindungen der Formel (X), bei der man von den Anhydriden der Formel (XLI-B) ausgeht. Die Verbindungen der Formel (XLI-B) sind teilweise bekannte oder käufliche Verbindungen.



Die Verbindungen der Formel (XXXII) wurden bereits bei den Vorstufen für das Verfahren (B) beschrieben.

Man erhält die Verbindungen der Formel (XXXII) beispielsweise auch, indem man substituierte 1,1,1-Trichlor-2-phenylethane der Formel (XLV)



in welcher

20

W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

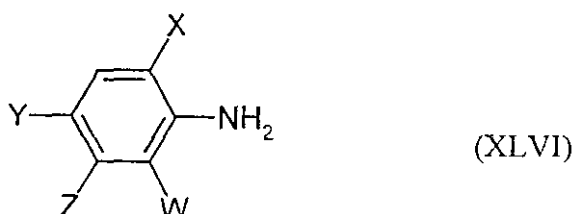
zunächst mit Alkoholaten (z.B. Alkalimetallalkoholaten wie Natriummethylat oder Natriummethylat) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. dem vom Alkoholat abgeleiteten Alkohol) bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, bevorzugt

25

zwischen 20°C und 120°C, und anschließend mit einer Säure (bevorzugt eine anorganische Säure wie z.B. Schwefelsäure) bei Temperaturen zwischen - 20°C und 150°C, bevorzugt 0°C und 100°C, umgesetzt (vgl. DE 3 314 249).

- 5 Die Verbindungen der Formel (LXV) sind neu, sie lassen sich nach im Prinzip bekannten Verfahren herstellen.

Man erhält die Verbindungen der Formel (XLV) beispielsweise, wenn man Aniline der Formel (XLVI)



10

in welcher

W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

- 15 in Gegenwart eines Alkylnitrits der Formel (XLVII)



in welcher

- 20 R^{21} für Alkyl, bevorzugt C_1 - C_6 -Alkyl steht,

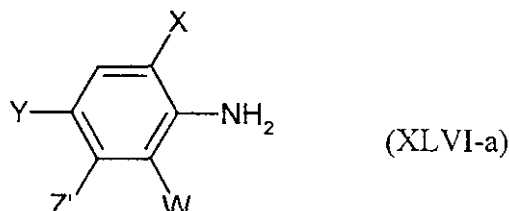
in Gegenwart von Kupfer(II)-chlorid und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. eines aliphatischen Nitrils wie Acetonitril) bei einer Temperatur von -20°C bis 80°C, bevorzugt 0°C bis 60°C, mit Vinylidenchlorid (CH₂=CCl₂) umgesetzt.

25

Die Verbindungen der Formel (XLVII) sind bekannte Verbindungen der Organischen Chemie. Kupfer(II)-chlorid und Vinylidenchlorid sind lange bekannt und käuflich.

- 30 Die Aniline der Formel (XLVI) sind teilweise neu.

Man erhält die Aniline der Formel (XLVI) beispielsweise indem man Aniline der Formel (XLVI-a)



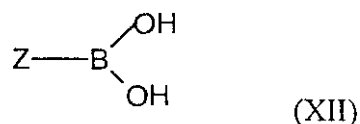
5

in welcher

W, X und Y die oben angegebene Bedeutung haben, und

10 Z' für Chlor oder Brom, bevorzugt für Brom steht,

mit Boronsäuren der Formel (XII)



15

in welcher

Z die oben angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Lösungsmittels, einer Base und eines Katalysators (bevorzugt
20 eines Palladiumkomplexes, wie z.B. Palladium-tetrakis (triphenylphosphin)) umgesetzt.

Die Aniline der Formel (XLVI-a) sind bekannte Verbindungen oder lassen sich im allgemeinen nach bekannten Verfahren herstellen.

25 Die bei dem obigen Verfahren (I) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formeln (I-1'a) bis (I-8'-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X und Y

die oben angegebene Bedeutung haben und Z' für Chlor und Brom, bevorzugt für Brom steht, sind teilweise bekannt (WO 96/35 664, WO 97/02 243 und WO 98/05 638) oder lassen sich gemäß den dort beschriebenen Verfahren oder nach Verfahren (A) bis (H) herstellen.

5

Die Boronsäuren der Formel (XII)



in welcher

10

Z die oben angegebene Bedeutung hat,

sind teilweise käuflich oder lassen sich nach allgemein bekannten Verfahren in einfacher Weise herstellen.

15

Die zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (J), (K), (L), (M), (N), (O) und (P) außerdem als Ausgangsstoffe benötigten Säurehalogenide der Formel (XIII), Carbonsäureanhydride der Formel (XIV), Chlorameisensäureester oder Chlorameisensäurethioester der Formel (XV), Chlormonothioameisensäureester oder Chlordithioameisensäureester der Formel (XVI), Sulfonsäurechloride der Formel (XVII), Phosphorverbindungen der Formel (XVIII) und Metallhydroxide, Metallalkoxide oder Amine der Formel (XIX) und (XX) und Isocyanate der Formel (XXI) und Carbamidsäurechloride der Formel (XXII) sind allgemein bekannte Verbindungen der Organischen bzw. Anorganischen Chemie.

20

Die Verbindungen der Formeln (VII), (VIII), (IX), (XIII) bis (XXIII), (XXVI), (XXVIII), (XXX), (XXXVI), (XL), (XLI) und (XLIV) sind darüber hinaus aus den eingangs zitierten Patentanmeldungen bekannt und/oder lassen sich nach den dort angegebenen Methoden herstellen.

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

5

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

10

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

15

20

25

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 150°C.

30

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

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

Das Verfahren (B) ist dadurch gekennzeichnet, daß Verbindungen der Formel (III), in welcher A, B, W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base einer intramolekularen Kondensation unterwirft.

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

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

hydrid und Calciumhydrid, und außerdem auch Alkalimetallalkoholate, wie Natrium-methylat, Natrium-ethylat und Kalium-tert.-butylat einsetzbar.

5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 150°C.

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

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

Das Verfahren (C) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (IV) in welcher A, B, W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben, in Gegenwart einer Säure und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels
20 intramolekular cyclisiert.

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

30 Gegebenenfalls kann auch die eingesetzte Säure als Verdünnungsmittel dienen.

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

5

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 150°C.

10

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

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

Die Verfahren (D- α) und (D- β) sind dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (V) oder (VI), in welchen W, X, Y, Z, R⁸ und Hal die oben angegebenen Bedeutungen haben mit Verbindungen der Formel (VII), in welcher A und D die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei den erfindungsgemäßen Verfahren (D- α) und (D- β) alle inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methyl-pyrrolidon, sowie, nur im Fall, daß Verbindungen der Formel (VI)

30

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

Als Base kommen in dem Fall, daß Verbindungen der Formel (V) eingesetzt werden,
5 anorganische Basen, insbesondere Alkali- oder Erdalkalicarbonate wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat oder Calciumcarbonat sowie organische Basen wie beispielsweise Pyridin oder Triethylamin in Betracht und in dem Fall, daß Verbindungen der Formel (VI) eingesetzt werden, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, -hydroxide und -carbonate, wie Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Magnesiumhydroxid, Calciumoxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat, die
10 auch in Gegenwart von Phasentransferkatalysatoren wie z.B. Triethylbenzylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Adogen 464 (= Methyltrialkyl(C₈-C₁₀)-ammoniumchlorid) oder TDA 1 (= Tris-(methoxyethoxyethyl)-amin) in Betracht, ferner Alkalimetalle wie Natrium oder Kalium, Alkalimetall- und Erdalkalimetallamide und -hydride, wie Natriumamid, Natriumhydrid und Calciumhydrid,
15 und außerdem auch Alkalimetallalkoholate, wie Natriummethylat und Kalium-tert-butylat.

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

Die erfindungsgemäßen Verfahren (D-α) und (D-β) werden im allgemeinen unter
25 Normaldruck durchgeführt.

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (D-α) und (D-β) setzt man die Reaktionskomponenten der Formeln (V) und (VII) oder (VI) und (VII) und die gegebenenfalls eingesetzte deprotonierenden Basen im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente
30 in einem größeren Überschuß (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

Das erfindungsgemäße Verfahren (E) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Carbo-
nylverbindungen der Formel (VIII) oder deren Enolether der Formel (VIII-a) mit
Ketensäurehalogeniden der Formel (V) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und
5 gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (E) alle iner-
ten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind
Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Glykol-
10 dimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie
Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid oder N-Methyl-pyrrolidon.

Als Säureakzeptoren können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Ver-
fahrensvariante E) alle üblichen Säureakzeptoren verwendet werden.

15 Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, Diaza-
bicyclooctan (DABCO), Diazabicycloundecan (DBU), Diazabicyclononen (DBN),
Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin.

20 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen
Verfahrensvariante E) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Zweck-
mäßigerweise arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugs-
weise zwischen 50°C und 220°C.

25 Das erfindungsgemäße Verfahren (E) wird zweckmäßigerweise unter Normaldruck
durchgeführt.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) setzt man die Reak-
tionskomponenten der Formeln (VIII) und (V), in welchen A, D, W, X, Y und Z die
30 oben angegebenen Bedeutungen haben und Hal für Halogen steht, und gegebenen-
falls die Säureakzeptoren im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist

jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) zu verwenden.

5 Das erfindungsgemäße Verfahren (F) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Thioamide der Formel (IX) mit Ketensäurehalogeniden der Formel (V) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt.

10 Als Verdünnungsmittel können bei der erfindungsgemäßen Verfahrensvariante F) alle inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methyl-pyrrolidon.

15 Als Säureakzeptoren können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) alle üblichen Säureakzeptoren verwendet werden.

Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicycloundecan (DBU), Diazabicyclononen (DBN),
20 Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Zweckmäßigerweise arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugsweise zwischen
25 20°C und 220°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (F) wird zweckmäßigerweise unter Normaldruck durchgeführt.

30 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) setzt man die Reaktionskomponenten der Formeln (IX) und (V), in welchen A, W, X, Y und Z die oben

angegebenen Bedeutungen haben und Hal für Halogen steht und gegebenenfalls die Säureakzeptoren im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) zu verwenden.

5

Das Verfahren (G) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (X), in welcher A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben, in Gegenwart einer Base einer intramolekularen Kondensation unterwirft.

- 10 Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (G) alle gegenüber den Reaktionsteilnehmern inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sul-
- 15 folan, Dimethylformamid und N-Methyl-pyrrolidon. Weiterhin können Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, iso-Propanol, Butanol, Isobutanol, tert.-Butanol eingesetzt werden.

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

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -75°C und 250°C, vorzugsweise zwischen -50°C und 150°C.

5

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

10

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

15

Das Verfahren (H) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (XI), in welcher A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebene Bedeutung haben, in Gegenwart von Basen einer intramolekularen Kondensation unterwirft.

20

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (H) alle gegenüber den Reaktionsteilnehmern inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methyl-pyrrolidon. Weiterhin können Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, iso-Propanol, Butanol, Isobutanol, tert.-Butanol eingesetzt werden.

25

Als Basen (Deprotonierungsmittel) können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) alle üblichen Protonenakzeptoren eingesetzt werden.

30

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

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 15 50°C und 150°C.

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

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

25 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (I) sind Palladium(O)-Komplexe als Katalysator geeignet. Bevorzugt wird beispielsweise Tetrakis-(triphenylphosphin)palladium. Gegebenenfalls können auch Palladium(II)-Verbindungen eingesetzt werden, beispielsweise PdCl₂.

30 Als Säureakzeptoren zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (I) kommen anorganische oder organische Basen in Frage. Hierzu gehören vorzugsweise

Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium-, Barium- oder Ammoniumhydroxid, Natrium-, Kalium-, Calcium- oder Ammoniumacetat, Natrium-, Kalium- oder Ammoniumcarbonat, Natriumhydrogen- oder Kaliumhydrogencarbonat, Alkali-
5 fluoride, wie beispielsweise Cäsiumfluorid, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

10

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (I) kommen Wasser, organische Lösungsmittel und beliebige Mischungen davon in Betracht. Beispielfhaft seien genannt: aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan,
15 Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Dicalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlor-, Trichlorethan oder Tetrachlorethylen; Ether, wie Diethyl-, Diisopropyl-, Methyl-t-butyl-, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether oder Anisol; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, iso-,
20 sek.- oder tert.-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonomethylether; Wasser.

Die Reaktionstemperatur kann bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (I) innerhalb
25 eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und +140°C, bevorzugt zwischen 50°C und +100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (I) werden Boronsäure der Formel (XII), in welcher Z die oben angegebene Bedeutung hat und Verbindungen
30 der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben, im molaren Verhältnis 1:1 bis 3:1,

vorzugsweise 1:1 bis 2:1 eingesetzt. Vom Katalysator setzt man im allgemeinen 0,005 bis 0,5 Mol, vorzugsweise 0,01 Mol bis 0,1 Mol pro Mol der Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) ein. Die Base setzt man im allgemeinen in einem Überschuß ein.

5

Das Verfahren (J- α) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) jeweils mit Carbonsäurehalogeniden der Formel (XIII) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

10

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

20

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

25

30

Die Reaktionstemperaturen können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (J- α) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und $+150^{\circ}\text{C}$, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C .

- 5 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J- α) werden die Ausgangsstoffe der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) und das Carbonsäurehalogenid der Formel (XIII) im allgemeinen jeweils in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäurehalogenid in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

10

Das Verfahren (J- β) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) mit Carbonsäureanhydriden der Formel (XIV) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

15

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (J- β) vorzugsweise diejenigen Verdünnungsmittel verwendet werden, die auch bei der Verwendung von Säurehalogeniden vorzugsweise in Betracht kommen. Im übrigen kann auch ein im Überschuß eingesetztes Carbonsäureanhydrid gleichzeitig als Verdünnungsmittel fungieren.

20

Als gegebenenfalls zugesetzte Säurebindemittel kommen beim Verfahren (J- β) vorzugsweise diejenigen Säurebindemittel in Frage, die auch bei der Verwendung von Säurehalogeniden vorzugsweise in Betracht kommen.

25

Die Reaktionstemperaturen können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (J- β) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und $+150^{\circ}\text{C}$, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C .

- 30 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J- β) werden die Ausgangsstoffe der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) und das Carbonsäureanhydrid der

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

- 5 Im allgemeinen geht man so vor, daß man Verdünnungsmittel und im Überschuß vorhandenes Carbonsäureanhydrid sowie die entstehende Carbonsäure durch Destillation oder durch Waschen mit einem organischen Lösungsmittel oder mit Wasser entfernt.
- 10 Das Verfahren (K) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) jeweils mit Chlorameisensäureestern oder Chlorameisensäurethioleestern der Formel (XV) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.
- 15 Als Säurebindemittel kommen bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (K) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, DABCO, DBU, DBA, Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calciumoxid, außerdem Alkali- und Erdalkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalihydroxide wie Natriumhydroxid und Kaliumhydroxid.

- Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (K) alle gegenüber den Chlorameisensäureestern bzw. Chlorameisensäurethioleestern inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenwasserstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüber hinaus Carbonsäureester, wie Ethylacetat, und auch stark polare Solventien, wie Dimethylsulfoxid und Sulfolan.
- 25
- 30

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

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

10

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) werden die Ausgangsstoffe der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) und der entsprechende Chlorameisensäureester bzw. Chlorameisensäurethiolester der Formel (XV) im allgemeinen jeweils in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder
15 andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 2 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen geht man so vor, daß man ausgefallene Salze entfernt und das verbleibende Reaktionsgemisch durch Abziehen des Verdünnungsmittels einengt.

20 Das erfindungsgemäße Verfahren (L) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) jeweils mit Verbindungen der Formel (XVI) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

25 Beim Herstellungsverfahren (L) setzt man pro Mol Ausgangsverbindung der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) ca. 1 Mol Chlormonothioameisensäureester bzw. Chlordithioameisensäureester der Formel (XVI) bei 0 bis 120°C, vorzugsweise bei 20 bis 60°C um.

Als gegebenenfalls zugesetzte Verdünnungsmittel kommen alle inerten polaren organischen Lösungsmittel in Frage, wie Ether, Amide, Sulfone, Sulfoxide, aber auch Halogenalkane.

- 5 Vorzugsweise werden Dimethylsulfoxid, Tetrahydrofuran, Dimethylformamid oder Methylenchlorid eingesetzt.

- 10 Stellt man in einer bevorzugten Ausführungsform durch Zusatz von starken Deprotonierungsmitteln wie z.B. Natriumhydrid oder Kaliumtertiärbutylat das Enolatsalz der Verbindungen (I-1-a) bis (I-8-a) dar, kann auf den weiteren Zusatz von Säurebindemitteln verzichtet werden.

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

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

- Das erfindungsgemäße Verfahren (M) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) jeweils mit Sulfonsäurechloriden der Formel (XVII) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

- 25 Beim Herstellungsverfahren (M) setzt man pro Mol Ausgangsverbindung der Formel (I-1-a bis I-8-a) ca. 1 Mol Sulfonsäurechlorid der Formel (XVII) bei -20 bis 150°C, vorzugsweise bei 20 bis 70°C um.

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

- 5 Vorzugsweise werden Dimethylsulfoxid, Tetrahydrofuran, Dimethylformamid, Methylenchlorid eingesetzt.

10 Stellt man in einer bevorzugten Ausführungsform durch Zusatz von starken Deprotonierungsmitteln (wie z.B. Natriumhydrid oder Kaliumtertiärbutilat) das Enolatsalz der Verbindungen (I-1-a) bis (I-8-a) dar, kann auf den weiteren Zusatz von Säurebindemitteln verzichtet werden.

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

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

20 Das erfindungsgemäße Verfahren (N) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) jeweils mit Phosphorverbindungen der Formel (XVIII) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

25 Beim Herstellungsverfahren (N) setzt man zum Erhalt von Verbindungen der Formeln (I-1-e) bis (I-8-e) auf 1 Mol der Verbindungen (I-1-a) bis (I-8-a), 1 bis 2, vorzugsweise 1 bis 1,3 Mol der Phosphorverbindung der Formel (XVIII) bei Temperaturen zwischen -40°C und 150°C, vorzugsweise zwischen -10 und 110°C um.

30

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

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

- Als gegebenenfalls zugesetzte Säurebindemittel kommen übliche anorganische oder organische Basen in Frage wie Hydroxide, Carbonate oder Amine. Beispielfhaft seien
10 Natriumhydroxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Pyridin, Triethylamin aufgeführt.

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

- 20 Das Verfahren (O) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) mit Metallhydroxiden bzw. Metallalkoxiden der Formel (XIX) oder Aminen der Formel (XX), gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umsetzt.

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

- Das erfindungsgemäße Verfahren (O) wird im allgemeinen unter Normaldruck
30 durchgeführt.

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

Das erfindungsgemäße Verfahren (P) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) jeweils mit (P- α) Verbindungen der Formel (XXI) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oder (P- β) mit Verbindungen der Formel (XXII) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

10

Bei Herstellungsverfahren (P- α) setzt man pro Mol Ausgangsverbindung der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) ca. 1 Mol Isocyanat der Formel (XXI) bei 0 bis 100°C, vorzugsweise bei 20 bis 50°C um.

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

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

20

Beim Herstellungsverfahren (P- β) setzt man pro Mol Ausgangsverbindung der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) ca. 1 Mol Carbamidsäurechlorid der Formel (XXII) bei -20 bis 150°C, vorzugsweise bei 0 bis 70°C um.

25

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

30

Vorzugsweise werden Dimethylsulfoxid, Tetrahydrofuran, Dimethylformamid oder Methylenchlorid eingesetzt.

5 Stellt man in einer bevorzugten Ausführungsform durch Zusatz von starken Deprotonierungsmitteln (wie z.B. Natriumhydrid oder Kaliumtertiärbutylat) das Enolatsalz der Verbindung (I-1-a) bis (I-8-a) dar, kann auf den weiteren Zusatz von Säurebindemitteln verzichtet werden.

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

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

20 Die Wirkstoffe eignen sich zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, vorzugsweise Arthropoden und Nematoden, insbesondere Insekten und Spinnentieren, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

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

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

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

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

30 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*.

5

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

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

10

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Phylloxera 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. *Frankliniella occidentalis*, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*.

15

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

20

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis 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 hederac*, *Pseudococcus* spp. *Psylla* spp.

25

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp. *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Spodoptera exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*,

30

Tineola bisselliella, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

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

- 15 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.,
20 *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Liriomyza* 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*.

- 25 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp.
Aus der Ordnung der Arachnida z.B. *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.

- Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp.,
30 *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..

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zeichnen sich durch eine hohe insektizide und akarizide Wirksamkeit nach Blatt- und Bodenanwendung aus.

Sie lassen sich mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von pflanzen-schädigenden Insekten einsetzen, wie beispielsweise gegen die Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*), gegen die Larven der grünen Reiszikade (10 *Nephotettix cincticeps*) und gegen die Larven der grünen Pfirsichblattlaus (*Myzus persicae*).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können weiterhin als Defolianten, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet 15 werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

20 Die zur Unkrautbekämpfung notwendigen Dosierungen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe liegen zwischen 0,001 und 10 kg/ha, vorzugsweise zwischen 0,005 und 5 kg/ha.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet 25 werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, 30 Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotola, Lindernia, Lamium, Veronica,

Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

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

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

20

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

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich sehr gut zur selektiven Bekämpfung monokotyler Unkräuter in dikotylen Kulturen im Vor- und Nachlaufverfahren. Sie

30

können beispielsweise in Baumwolle oder Zuckerrüben mit sehr gutem Erfolg zur Bekämpfung von Schadgräser eingesetzt werden.

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

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

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

25 Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:
z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und
30 Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie

synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

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

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

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 % und daneben bevorzugt Streckmittel und/oder oberflächenaktive Mittel.

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

Besonders günstige Mischpartner sind z.B. die folgenden:

Fungizide:

- 2-Aminobutan; 2-Anilino-4-methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin; 2',6'-Dibromo-2-methyl-4'-trifluoromethoxy-4'-trifluoro-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid; 2,6-Dichloro-N-(4-trifluoromethylbenzyl)-benzamid; (E)-2-Methoxyimino-N-methyl-2-(2-phenoxyphenyl)-acetamid; 8-Hydroxyquinolinsulfat; Methyl-(E)-2-{2-[6-(2-cyano-phenoxy)-pyrimidin-4-yloxy]-phenyl}-3-methoxyacrylat; Methyl-(E)-methoximino-[alpha-(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetat; 2-Phenylphenol (OPP), Aldimorph, Ampropylfos, Anilazin, Azaconazol, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazole, Bupirimate, Buthiobate, Calciumpolysulfid, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Chinomethionat (Quinomethionat), Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazole, Cyprofuram, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithion, Ditalimfos, Dithianon, Dodine, Drazoxolon, Edifenphos, Epoxyconazole, Ethirimol, Etridiazol, Fenarimol, Fenbuconazole, Fenfuram, Fenitropan, Fenciclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzone, Fluazinam, Fludioxonil, Fluoromide, Fluquinconazole, Flusilazole, Flusulfamide, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fthalide, Fuberidazol, Furalaxyl, Furmecyclohex, Guazatine, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol, Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iprobenfos (IBP), Iprodion, Isoprothiolan, Kasugamycin, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung, Mancopper, Mancozeb, Maneb, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metsulfovax, Myclobutanil,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,
Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxycarboxin,
Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Phthalid, Pimaricin, Piperalin,
Polycarbamate, Polyoxin, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propi-
5 conazole, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon,
Quintozen (PCNB),
Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,
Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thio-
phanat-methyl, Thiram, Tolclophos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol,
10 Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
Validamycin A, Vinclozolin,
Zineb, Ziram.

Bakterizide:

15 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,
Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Teclof-
talam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

20 Abamectin, AC 303 630, Acephat, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Alphamethrin,
Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azinphos A, Azinphos M, Azo-
cyclotin,
Bacillus thuringiensis, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Betacyfluthrin, Bifen-
thrin, BPMC, Brofenprox, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butocarboxim,
25 Butylpyridaben,
Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA 157
419, CGA 184699, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron,
Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Cis-Resmethrin, Clocythrin, Clofen-
tezin, Cyanophos, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin,
30 Cyromazin,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicliphos, Dicrotophos, Diethion, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Dioxathion, Disulfoton, Edifenphos, Enamectin, Esfenvalerat, Ethiofencarb, Ethion, Ethofenprox, Ethoprophos, Etrimphos, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatinoxid, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyroximat, Fenthion, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flufenprox, Fluvinate, Fonophos, Formothion, Fosthiazat, Fubfenprox, Furathiocarb, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Imidacloprid, Iprobenfos, Isazophos, Isafenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Lambda-cyhalothrin, Lufenuron, Malathion, Mecarbam, Mevinphos, Mesulfenphos, Metaldehyd, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Milbemectin, Monocrotophos, Moxidectin, Naled, NC 184, NI 25, Nitenpyram, Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M, Oxydeprofos, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalon, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos M, Pirimiphos A, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozin, Pyrachlophos, Pyridaphenthion, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyrimidifen, Pyriproxifen, Quinalphos, RH 5992, Salithion, Sebufos, Silafluofen, Sulfotep, Sulprofos, Tebufenozid, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thiafenox, Thiodicarb, Thiofanox, Thiomethon, Thionazin, Thuringiensin, Tralomethrin, Triarathen, Triazophos, Triazuron, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, XMC, Xylcarb, YI 5301 / 5302, Zetamethrin.

Herbizide:

beispielsweise Anilide, wie z.B. Diflufenican und Propanil; Arylcarbonsäuren, wie z.B. Dichlorpicolinsäure, Dicamba und Picloram; Aryloxyalkansäuren, wie z.B. 2,4 D, 2,4 DB, 2,4 DP, Fluroxypyr, MCPA, MCPP und Triclopyr; Aryloxy-phenoxy-alkansäureester, wie z.B. Diclofop-methyl, Fenoxaprop-ethyl, Fluazifop-butyl, Haloxypyr-methyl und Quizalofop-ethyl; Azinone, wie z.B. Chloridazon und Norflurazon; Carbamate, wie z.B. Chlorpropham, Desmedipham, Phenmedipham und Propam; Chloracetanilide, wie z.B. Alachlor, Acetochlor, Butachlor, Metazachlor, Metolachlor, Pretilachlor und Propachlor; Dinitroaniline, wie z.B. Oryzalin, Pendimethalin und Trifluralin; Diphenylether, wie z.B. Acifluorfen, Bifenox, Fluoroglycofen, Fomesafen, Halosafen, Lactofen und Oxyfluorfen; Harnstoffe, wie z.B. Chlortoluron, Diuron, Fluometuron, Isoproturon, Linuron und Methabenzthiazuron; Hydroxylamine, wie z.B. Alloxymid, Clethodim, Cycloxydim, Sethoxydim und Tralkoxydim; Imidazolinone, wie z.B. Imazethapyr, Imazamethabenz, Imazapyr und Imazaquin; Nitrile, wie z.B. Bromoxynil, Dichlobenil und Ioxynil; Oxyacetamide, wie z.B. Mefenacet; Sulfonylharnstoffe, wie z.B. Amidosulfuron, Bensulfuron-methyl, Chlorimuron-ethyl, Chlorsulfuron, Cinosulfuron, Metsulfuron-methyl, Nicosulfuron, Primisulfuron, Pyrazosulfuron-ethyl, Thifensulfuron-methyl, Triasulfuron und Tribenuron-methyl; Thiolcarbamate, wie z.B. Butylate, Cycloate, Diallylate, EPTC, Esprocarb, Molinate, Prosulfocarb, Thiobencarb und Triallate; Triazine, wie z.B. Atrazin, Cyanazin, Simazin, Simetryne, Terbutryne und Terbutylazin; Triazinone, wie z.B. Hexazinon, Metamitron und Metribuzin; Sonstige, wie z.B. Aminotriazol, Benfuresate, Bentazone, Cinmethylin, Clomazone, Clopyralid, Difenzoquat, Dithiopyr, Ethofumesate, Fluorochloridone, Glufosinate, Glyphosate, Isoxaben, Pyridate, Quinchlorac, Quinmerac, Sulphosate und Tridiphane.

Der erfindungsgemäße Wirkstoff kann ferner in seinen handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die

Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

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

10 Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

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

15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, 20 Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp..

25 Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp..

30 Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp.,

Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Aus der Ordnung der Siphonapterida z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

10 Aus der Ordnung der Heteropterida z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Aus der Ordnung der Blattarida z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp..

15

Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodoros spp., Oribatius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

20

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

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse,

30

Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.)
5 vermindert werden, so daß durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

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

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

25 Außerdem wurde gefunden, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.

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

Käfer wie

- Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufo-
villosum, Ptilinus pecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium
carpini, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis,
5 Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis, Xyleborus spec.
Tryptodendron spec. Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus
brunneus, Sinoxylon spec. Dinoderus minutus.

Hautflügler wie

- 10 Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur.

Termiten wie

- Kaloterme flavicollis, Cryptoterme brevis, Heteroterme indicola, Reticuliterme
flavipes, Reticuliterme santonensis, Reticuliterme lucifugus, Mastoterme dar-
15 winiensis, Zootermopsis nevadensis, Coptoterme formosanus.

Borstenschwänze wie

Lepisma saccharina.

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

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

- Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße
Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft
zu verstehen: Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege,
30 Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen,

Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

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

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

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

20 Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

25 Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder ölarartiges schwerflüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

30 Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölarartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb

30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle oder deren Aromatenfraktionen oder mineralöhlhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

5

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

10

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

20

Die organischen schwerflüchtigen öligen oder ölartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, daß das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und daß das Insektizid-Fungizid-Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

25

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

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

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

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

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

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphos-

phat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykol-ether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

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

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

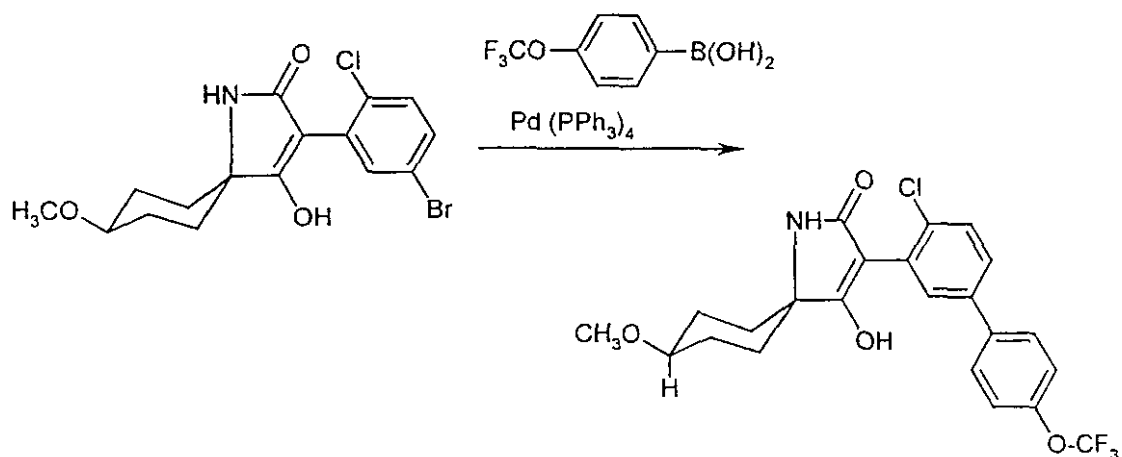
Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.

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

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

- Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner seien Insektizide, wie Chlorpyrifos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron und Triflumuron, sowie
25 Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolyfluanid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbammat, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octyl-isothiazolin-3-on genannt.

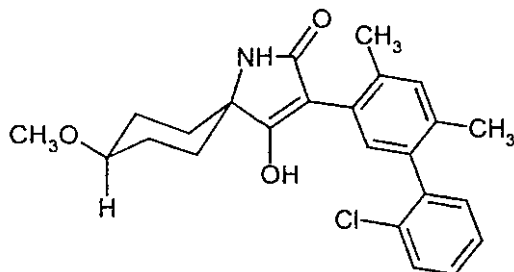
- 30 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Beispiel I-1a-1

5

1,93 g der oben gezeigten Bromverbindung in 20 ml 1,2-Dimethoxyethan werden bei 20°C mit 1,6 g 4-Trifluormethoxyphenylboronsäure und 0,29 g Tetrakis(trisphenylphosphin)palladium versetzt. Man rührt 15 Minuten bei 20°C, gibt 15 ml 20 %ige Natriumcarbonatlösung zu und rührt einen Tag bei 80°C. Die Lösung wird filtriert und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die wäßrige Phase wird bei 0 bis 10°C mit konzentrierter Salzsäure angesäuert, bis zur Trockne im Vakuum eingengt und der Rückstand mit Methylenchlorid/Essigester 3:1 als Laufmittel an Kieselgel chromatographiert.

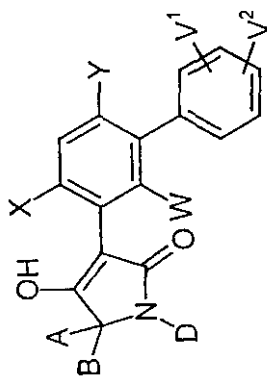
15 Ausbeute 0,40 g (17 % der Theorie); Fp.: 143°C.

Beispiel I-1a-14

- 5 Zu 2,6 g Kalium-tert.-butylat in 7 ml absolutem Dimethylformamid (DMF) tropft man bei 80°C 4,42 g der Verbindung gemäß Beispiel (II-10) in 9 ml absolutem DMF und rührt bei dieser Temperatur, bis die Reaktion beendet ist (dünnschichtchromatographische (DC) Kontrolle). Nach dem Abkühlen gibt man 90 ml Eiswasser zu und säuert bei 0°C bis 10°C mit konz. Salzsäure auf pH 2 an. Man saugt ab, wäscht mit
- 10 Eiswasser, trocknet und kocht mit Methyl-tert.-butylether (MTBE)/n-Hexan aus.

Ausbeute 2,81 g (68 % der Theorie), Fp.: 204°C.

In Analogie zu den Beispielen I-1-a-1 und I-1-a-14 und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung von Verbindungen der Formel I-1-a wurden folgende Verbindungen hergestellt:

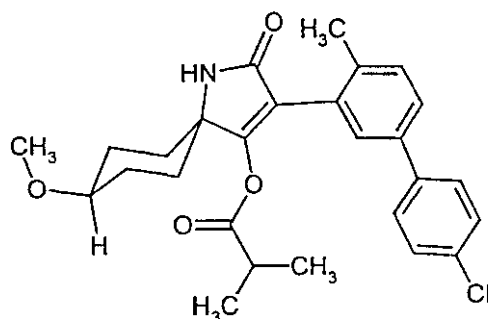


Bsp.-Nr.	W	X	Y	V1	V2	D	A	B	Fp. (°C)	Isomer
I-1-a-2*	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-3*	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-4*	CH ₃	OCH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-5*	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-6*	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-7*	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>250	-
I-1-a-8*	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>240	-
I-1-a-9*	H	Cl	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CH-OCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-10*	H	Cl	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-11*	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-12*	H	Cl	OCH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-13*	H	Cl	OCH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		134	β

Fortsetzung Tabelle mit Verbindungen der Formel I-a

Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	Fp. (°C)	Isomer
I-1-a-14	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		204	β
I-1-a-15	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		156	-
I-1-a-16*	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		185	β
I-1-a-17	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		>245	β
I-1-a-18	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₃	CH ₃	222	-
I-1-a-19	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		185	β
I-1-a-20	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>250	-
I-1-a-21	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>240	-
I-1-a-22	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>240	-
I-1-a-23	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		208	β
I-1-a-24	H	C ₂ H ₅	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		138	β
I-1-a-25	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		238	β
I-1-a-26	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>250	-
I-1-a-27	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>235	-

* hergestellt via Suzuki-Kupplung analog Bsp. I-1-a-1

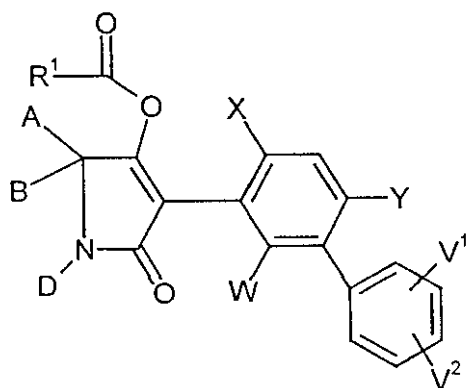
Beispiel I-1-b-1

- 5 Zu 1 g der Verbindung gemäß Beispiel (I-1-a-16) und 0,5 ml Triethylamin in 30 ml Essigsäureethylester (EE) gibt man unter Rückfluß 0,4 ml Isobuttersäurechlorid und rührt, bis die Reaktion beendet ist (DC-Kontrolle). Es wird eingeeengt und chromatographisch an Kieselgel gereinigt.

- 10 Laufmittel Methylenchlorid/EE 10/1

Ausbeute 0,15 g (11 % der Theorie), Fp.: 201°C.

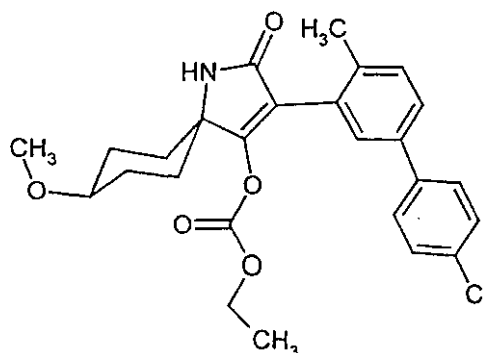
Analog zu Beispiel (I-1-b-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I-1-b) wurden folgende Verbindungen hergestellt:



(I-1-b)

15

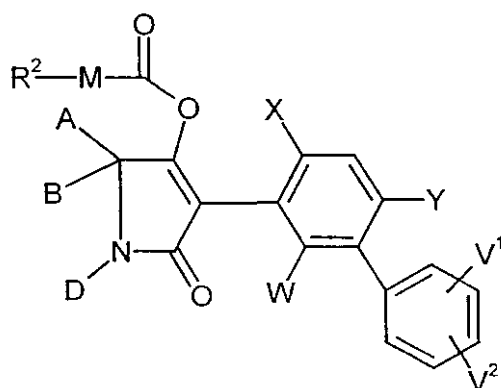
Bsp.- Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	R ¹	Fp.°C	Isomer
I-1- b-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	>230	β

Beispiel I-1-c-1

- 5 Zu 1 g der Verbindung gemäß Beispiel (I-1-a-16) und 0,5 ml Triethylamin in 30 ml Methylenchlorid gibt man bei 0°C 0,35 g Chlorameisensäureethylester und rührt einen Tag bei 20°C. Es wird eingeeengt und der Rückstand chromatographisch an Kieselgel gereinigt.

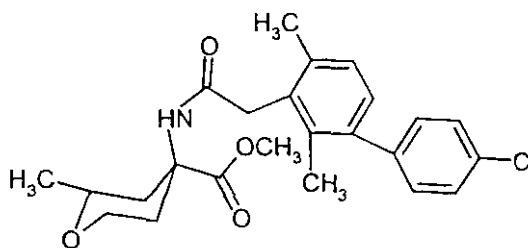
- 10 Laufmittel Methylenchlorid/EE 10/1
Ausbeute 0,12 g, Fp.: 194°C.

Analog zu Beispiel (I-1-c-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I-1-c) wurden folgende Verbindungen hergestellt:



(I-1-c)

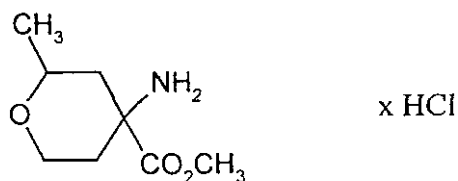
Bsp.- Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	M	R ²	Fp.°C	Isomer
I-1- c-2	H	CH ₃	H	Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	187	β
I-1- c-3	H	CH ₃	H	Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	>240	-
I-1- c-4	H	CH ₃	H	Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	i-C ₄ H ₉	168	β
I-1- c-5	H	CH ₃	H	Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	149	-

Beispiel II-1

5

5 g der Verbindung gemäß Beispiel (XXVII-5) und 7,6 ml Thionylchlorid werden auf 80°C erhitzt, bis die Gasentwicklung beendet ist. Überschüssiges Thionylchlorid wird entfernt, der Rückstand in 20 ml Acetonitril aufgenommen (Lösung 1).

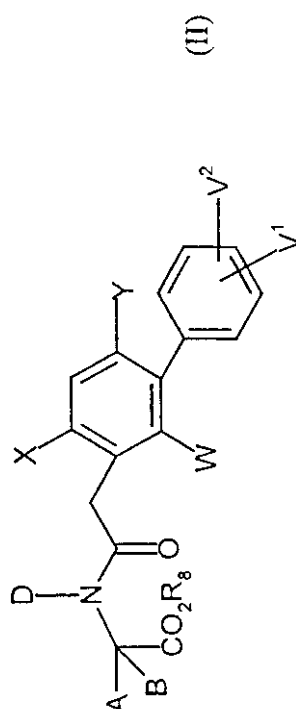
10 Man legt 4,61 g der Verbindung



in 20 ml Acetonitril vor, gibt 6,1 g gemahlene Kaliumcarbonat zu, tropft bei 0-10°C Lösung 1 zu und rührt noch 1 Stunde bei Raumtemperatur. Die Mischung wird auf 250 ml Eiswasser gegossen. Man extrahiert mit Methylchlorid, wäscht mit 0,5 N HCl und engt ein. Der Rückstand wird an Kieselgel chromatographiert (Laufmittel Methylchlorid/EE 3/1), Ausbeute 5 g, Fp.: 91°C.

15

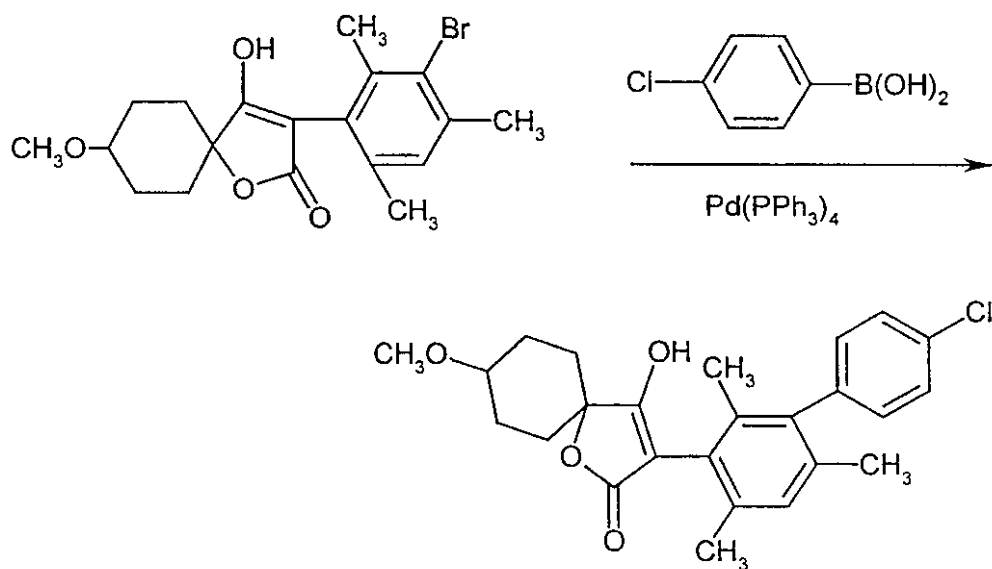
Analog zu Beispiel II-1 und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung der Verbindungen der Formel (II) erhält man folgende Beispiele der Formel (II)



Bsp.-Nr.	W	X	Y	V1	V2	D	A	B	R ⁸	Fp. (°C)	Isomer
II-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	125	-
II-3	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	76	β
II-4	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	179	-
II-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	186	β
II-6	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	169	-
II-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	194	β
II-8	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	123	-
II-9	H	C ₂ H ₅	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	109	β
II-10	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	121	β

Fortsetzung Tabelle mit Verbindungen der Formel (II)

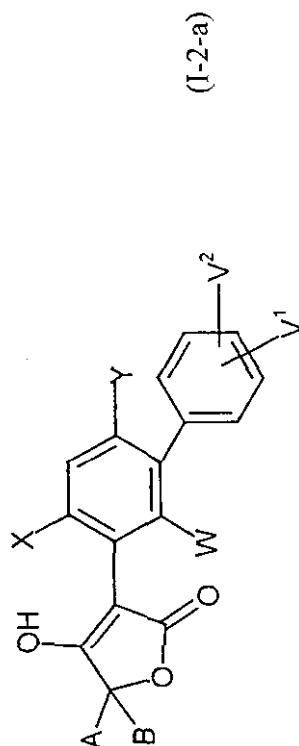
Bsp.-Nr.	W	X	Y	V1	V2	D	A	B	R ⁸	Fp. (°C)	Isomer
II-11	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	165	-
II-12	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	139	β
II-13	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	185	-
II-14	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CH CH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	145	β
II-15	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	154	-
II-16	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	76	β
II-17	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	137	-
II-18	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	166	-

Beispiel (I-2-a-1)

5 Zu 1,55 g der o.g. Brom-Verbindung erhältlich gemäß den Beispielen aus WO 97/36868, 0,73 g 4-Chlorphenylboronsäure und 0,27 g Tetrakis-triphenylphosphin- palladium in 20 ml Dimethoxyethan gibt man 19,5 ml 20 %ige Natriumcarbonat- lösung und rührt 4 Stunden bei 80°C. Man versetzt mit 1N NaOH und extrahiert 2 mal mit Ether. Die alkalische Phase wird filtriert und mit verdünnter Salzsäure angesäuert. Man saugt ab und trocknet. Ausbeute 0,36 g, Fp. 260-263°C.

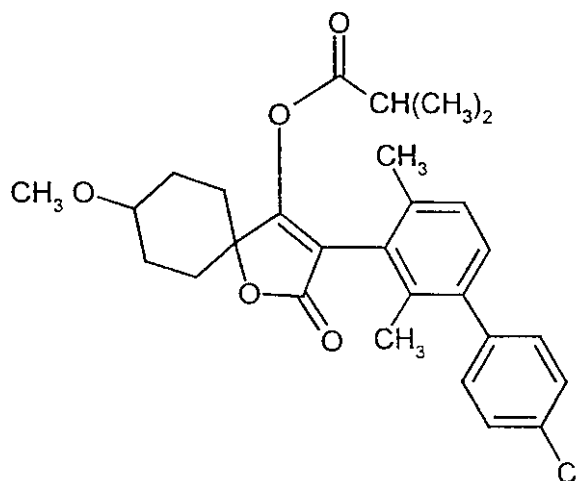
Analog zu Beispiel I-2-a-1 bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-2-a) erhält man folgende

Beispiele der Formel (I-2-a)



Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Fp. (°C)
I-2-a-2	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		243-245
I-2-a-3	H	Cl	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		1)

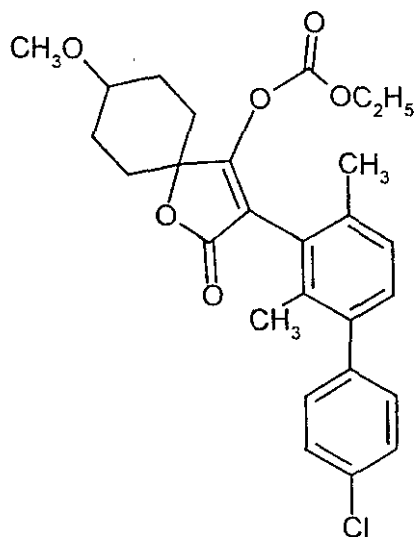
1) ¹H-NMR (300 MHz, d₆-DMSO): δ = 3,27, 3,29 (2s, 3H, OCH₃), 7,51-7,71 (m, 7H, ArH) 12,6 (br, 1H, OH).

Beispiel I-2-b-1

- 5 0,125 g (0,3 mmol) der Verbindung I-2-a-2 werden in absolutem Methylenchlorid vorgelegt mit 0,04 g (0,36 mmol) Triethylamin versetzt und bei 0-10°C 0,04 g (0,36 mmol) Isobuttersäurechlorid zugetropft. Die Mischung wird über Nacht gerührt, anschließend einmal mit 10 %iger Zitronensäure und einmal mit 10 %iger Natronlauge gewaschen, die organische Phase getrocknet und eingeeengt.

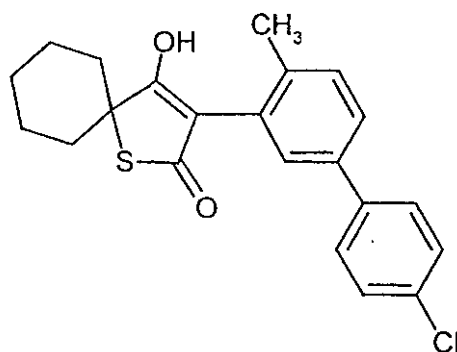
10 Ausbeute: 0,1 g Öl

¹H-NMR (300 MHz, CDCl₃): δ = 2,06, 2,07 (2s, 3H, Ar CH₃), 2,24, 2,25 (2s, 3H, Ar CH₃), 2,61 (m, 1H, CH(CH₃)₂), 3,35, 3,40 (2s, 3H, OCH₃), 7,09 (s, 2H, ArH), 7,16, 7,19 (AA', BB', 1H, Ar-H), 7,35, 7,37 (AA', BB', 2H, ArH).

Beispiel I-2-c-1

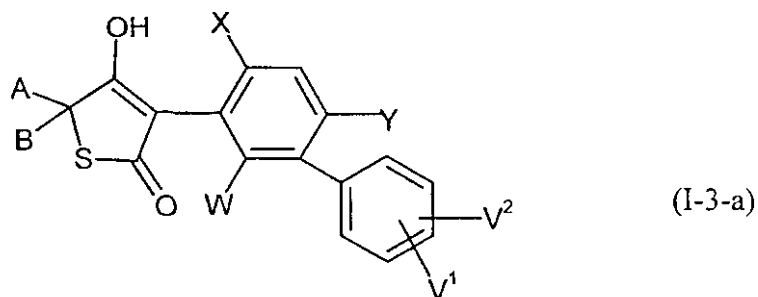
- 5 Herstellung analog zu Beispiel I-2-b-1 durch Umsetzung der Verbindung gemäß Beispiel I-2-a-2 mit Chlorameisensäure-ethylester. Öl

¹H-NMR (300 MHz, CDCl₃): δ = 1,10, (t, 3H, O-CH₂CH₃), 2,08, (2s, 3H, Ar CH₃),
2,24, 2,25 (2s, 3H, ArCH₃), 3,36, 3,40 (2s, 3H, OCH₃), 7,11 (2s, 2H, ArH), 7,18,
10 7,21 (AA', BB', 2H, ArH), 7,35, 7,38 (AA', BB', 2H, ArH).

Beispiel I-3-a-1

- 5 44 g der Verbindung gemäß Beispiel IV-1 und 92 ml Trifluoressigsäure werden in 210 ml Toluol über Nacht unter Rückfluß erhitzt. Es wird eingeeengt und der Rückstand in 600 ml Wasser und 200 ml MTBE aufgenommen. Durch Zugabe von NaOH wird auf pH 14 eingestellt und dann 2 mal mit MTBE extrahiert. Die wässrige Phase wird in 1 l 1N HCl getropft. Man rührt 2 Stunden, extrahiert mit Methylenchlorid und engt ein. Zur Reinigung wird der Rückstand mit ca. 200 ml MTBE/Cyclohexan 8/1 verrührt, abgesaugt und getrocknet. Ausbeute 5,9 g, Fp. 232-235°C.
- 10

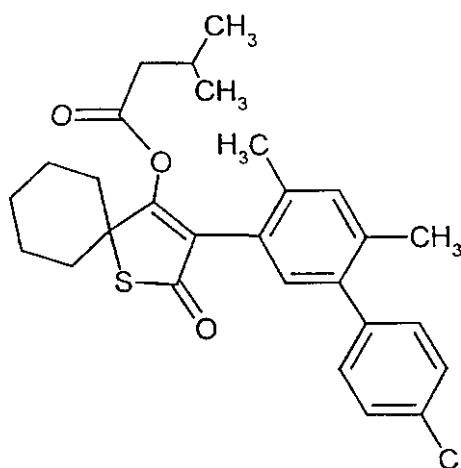
Analog zu Beispiel (I-3a-1) bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-3-a) erhält man folgende Verbindungen



Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Fp. (°C)
I-3-a-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		245-247
I-3-a-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		248-250

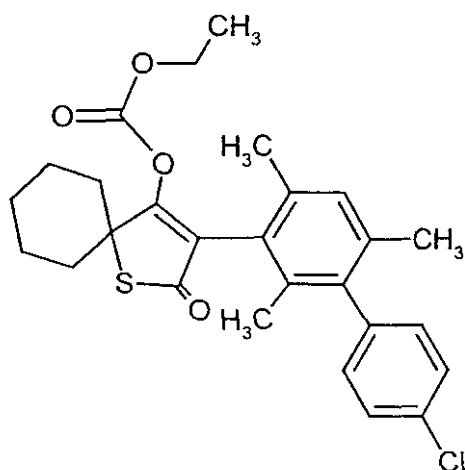
5

Beispiel I-3-b-1



Herstellung analog Beispiel I-2-b-1, durch Umsetzung der Verbindung gemäß
10 Beispiel I-3-a-2 mit Isovaleriansäurechlorid.

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ=0,9 (d, 6H, CH-CH₃); 1,2-2,0 (m, 10H, Cyclohexyl-H); 2,1, 2,2 (s, 6H, 2xArCH₃); 6,85-7,5 (m, 6H, ArH) ppm.

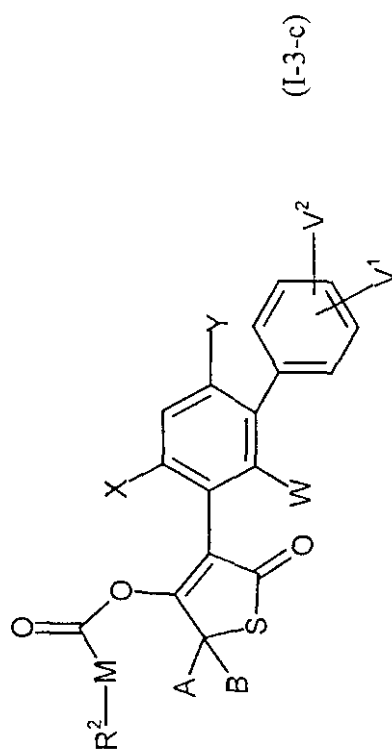
Beispiel I-3-c-1

- 5 Herstellung analog Beispiel I-2-c-1, durch Umsetzung der Verbindung gemäß Beispiel I-3-a-3 mit Chlorameisensäureethylester. Öl.

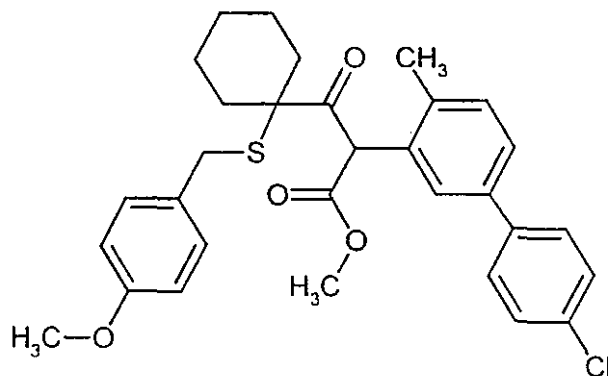
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=0,95$ (t, 3H, CH_2CH_3); 1,3-1,9 (m, 10H, Cyclohexyl-H); 1,9 (s, 3H, ArCH_3); 2,1 (s, 6H, 2 x Ar-CH_3); 4,0 (g, 2H, OCH_2);

- 10 7,0-7,5 (m, 5H, Ar-H) ppm.

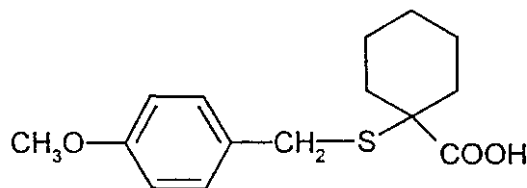
Analog zu Beispiel (I-3-c-1) bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-3-c) erhält man folgende Verbindungen



Bsp.-Nr.	W	X	Y	V¹	V²	A	B	M	R²	Fp. (°C)
I-3-c-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H		-(CH ₂) ₅ -	O	C ₂ H ₅	Öl

Beispiel IV-1

A: 15 g (53,5 mmol) der Verbindung

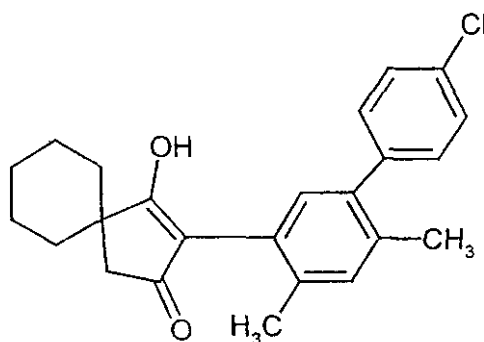


5 werden auf übliche Weise mit 9,63 g (80,3 mmol) Thionylchlorid in das entsprechende Säurechlorid überführt und in 30 ml Tetrahydrofuran (THF) gelöst.

10 B: Zu 45,8 ml (96,3 mmol, 1,1 eq) Lithiumdiisopropylamid (LDA)-Lösung in 100 ml THF tropft man bei 0°C 27 g (87,5 mmol) der Verbindung gemäß Beispiel XXXII-2, rührt 30 Minuten bei dieser Temperatur und tropft dann die unter A hergestellte Lösung zu. Ohne Kühlung wird noch 1 Stunde gerührt. Man setzt 300 ml MTBE und einige Tropfen Wasser zu, wäscht 2 mal mit je 300 ml 10 %iger NH₄Cl-Lösung und engt ein. Ausbeute 44 g.

15 Öl.

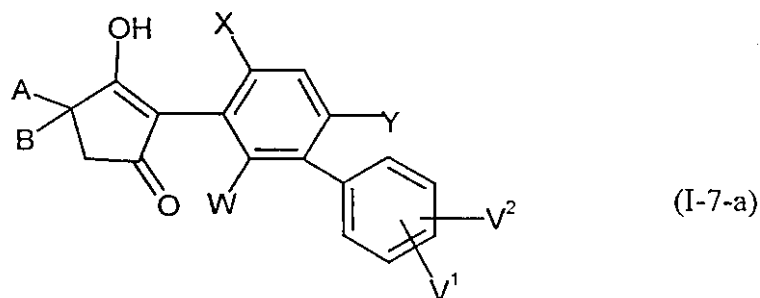
¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ=1,2-2,0 (m, 10H, Cyclohexyl-H); 2,25 (s, 3H, Ar-CH₃); 3,1 (dd, 2H, SCH₂); 3,6-3,7 (s, 6H, 2xOCH₃); 6,7-7,7 (m, 12H, Ar-H) ppm.

Beispiel I-7-a-1

- 5 5,3 g (12,8 mmol) der Verbindung gemäß Beispiel X-1 werden in 20 ml DMF vorgelegt mit 2,2 g (19,2 mmol, 1,5 eq) Kalium-ter.-butylat versetzt und 1 Stunde auf 80°C erwärmt (DC-Kontrolle),

- 10 Dann läßt man das Gemisch langsam in ca. 0,6 l 1N HCl (unter Eiskühlung) zulaufen, saugt ab und trocknet. Ausbeute 4,85 g, Fp. 224-226°C.

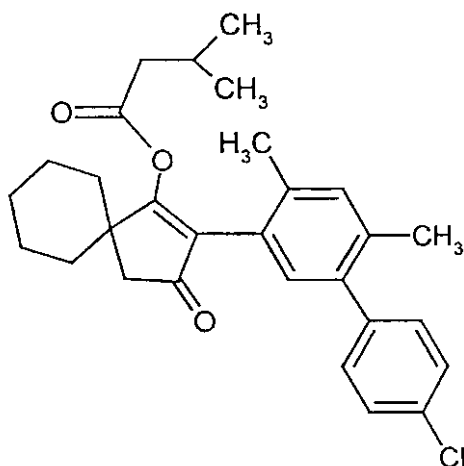
Analog zu Beispiel (I-7-a-1) bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-7-a) erhält man folgende Verbindungen



Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Fp. (°C)
I-7-a-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		223-224
I-7-a-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		>250

5

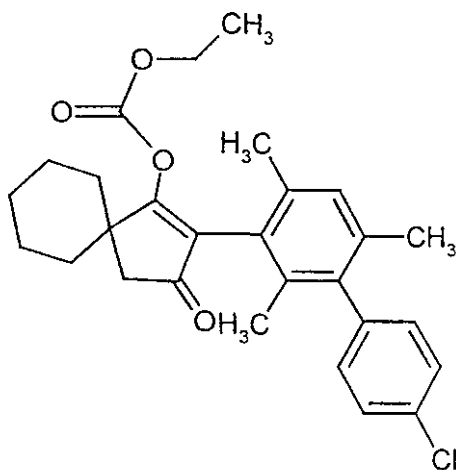
Beispiel I-7-b-1



Herstellung analog Beispiel (I-2-b-1) durch Umsetzung der Verbindung gemäß Beispiel (I-7-a-1) mit Isovaleriansäurechlorid. Ausbeute 1,26 g eines Öls.

10

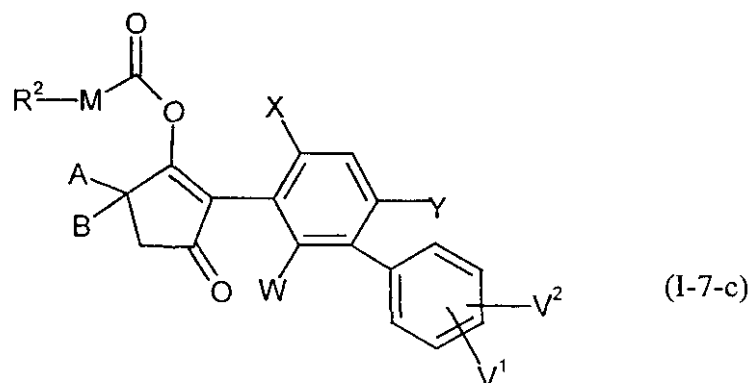
¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ=0,95 (d, 6H, 2xCH-CH₃); 1,2-1,8 (m, 10H, Cyclohexyl-H); 2,1, 2,2 (s, 6H, 2xAr-CH₃); 6,8-7,5 (m, 6H, Ar-H) ppm.

Beispiel I-7-c-1

- 5 Herstellung analog Beispiel (I-2-c-1) durch Umsetzung der Verbindung gemäß Beispiel (I-7-a-3) mit Chlorameisensäureethylester. Ausbeute 1,3 g. Wachs.

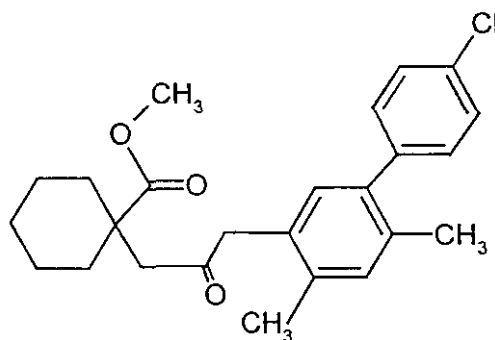
¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): 1,2 (t, 3H, CH₂CH₃); 1,3-1,8 (m, 10H, Cyclohexyl); 1,65, 1,9, 2,05 (s, 3 x 3H, Ar-CH₃); 3,05 (bs, 2H, Cyclopentyl CH₂);
10 4,2 (q, 2H, OCH₂); 7,0 - 7,5 (m, 5H, Ar-H).

Analog zu Beispiel (I-7-c-1) bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-7-c) erhält man folgende Verbindungen



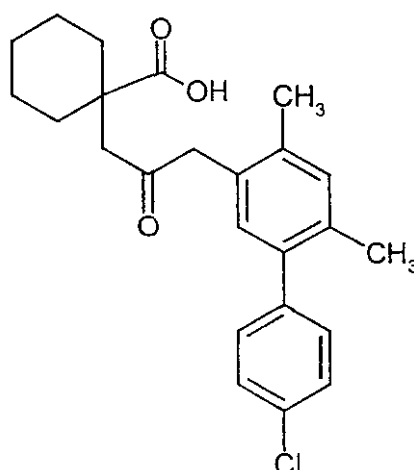
Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	M	R ²	Fp. (°C)
I-7-c-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	Öl

5 Beispiel X-1

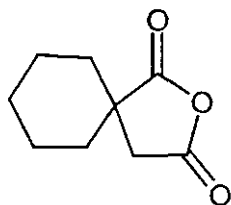


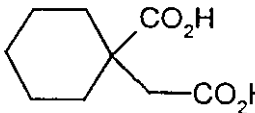
24 g Rohprodukt der Verbindung gemäß Beispiel (XXXVIII-1) werden in 140 ml Aceton mit 8,2 g Kaliumcarbonat und 25,4 g Methyljodid 16 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Man filtriert, engt ein und reinigt den Rückstand an Kieselgel: Laufmittel, 10 Methylenchlorid/Petrolether 2/1, schließlich reines Methylenchlorid. Ausbeute 5,6 g.

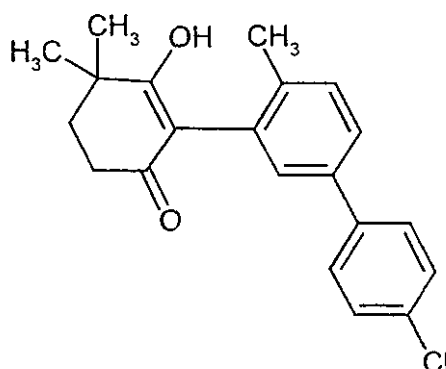
¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ=1,2-1,8 (m, 10H, Cyclohexyl H); 2,1, 2,2 (s, 6H, 2xAr-CH₃); 2,9, 3,8 (s, 4H, 2xCOCH₂); 3,5 (s, 3H, OCH₃); 6,95-7,5 (s, 6H, Ar-H) ppm.

Beispiel XXXVIII-1

- 5 Zu einer Lösung von 30 ml LDA-Lösung (2 m, 1,1 eq) in 60 ml THF wird eine Lösung von 17,9 g der Verbindung gemäß Beispiel XXXII-1 bei -15°C getropft und 1 Stunde bei 0°C gerührt. Dann wird bei -15°C eine Lösung von 6,1 g der Verbindung gemäß Beispiel XLI-1 in 10 ml THF getropft. Man rührt 2 Stunden bei Raumtemperatur, gibt 100 ml Wasser und 24 g Ammoniumchlorid zu und säuert mit
- 10 konz. HCl an. Das Zwischenprodukt wird mit Ether extrahiert. Man engt ein und erhitzt den Rückstand zwei Tage mit 60 g KOH in 220 ml Wasser. Nach dem Abkühlen wird mit konz. HCl angesäuert und mit Ether extrahiert. Das Rohprodukt wird ohne weitere Reinigung weiter umgesetzt. Ausbeute 24 g.

Beispiel XLI-1

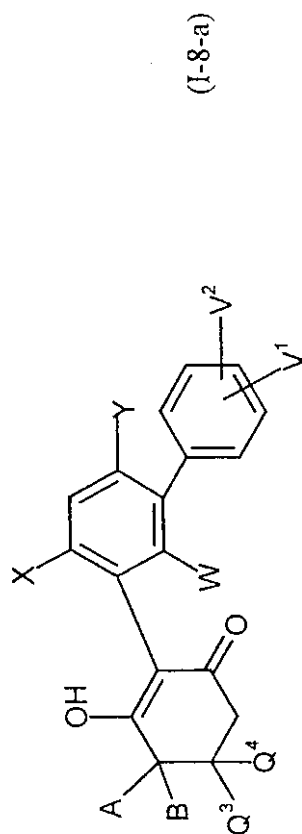
100 g der Verbindung  werden über Nacht in 500 ml Essig-
 5 säureanhydrid unter Rückfluß erhitzt. Man engt ein, löst in wenig Methylenchlorid
 und versetzt mit n-Hexan. Man beläßt über Nacht im Kühlschrank, saugt ab und
 trocknet. Ausbeute 74,8 g.

Beispiel I-8-a-1

10 Zu 2,1 g der Verbindung gemäß Beispiel (XI-1) in 10 ml DMF gibt man 0,95 g
 Kalium-tert.-butylat und erhitzt 2 Stunden auf 80°C. Unter Eiskühlung läßt man das
 Gemisch langsam in ca. 1 l 1N HCl laufen und saugt den Niederschlag ab.
 Ausbeute 0,2 g.

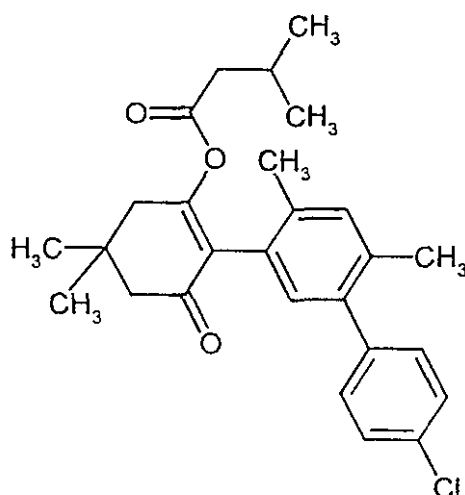
15 ¹H-NMR, (400 MHz, d₆-DMSO): δ=1,1 (s, 6H, C-CH₃); 1,85 (m, 2H, COCH₂CH₂);
 2,0 (s, 3H, ArCH₃); 2,65 (m, 2H, COCH₂CH₂); 7,1-7,6 (m, 7H, Ar-H) ppm.

Analog zu Beispiel I-8-a-1 bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I-8-a) erhält man folgende Verbindungen



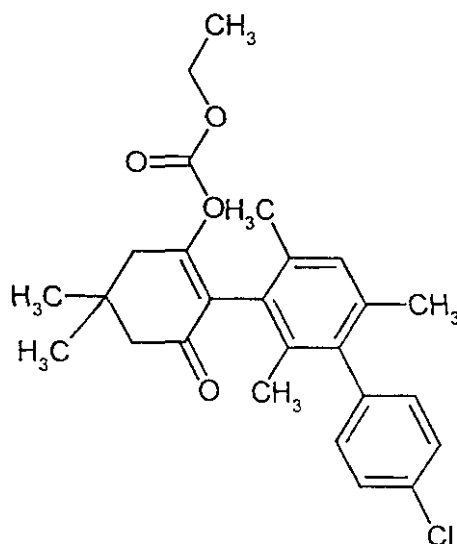
(I-8-a)

Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Q ³	Q ⁴	Fp.°C
I-8-a-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	223-225
I-8-a-3	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	Harz
I-8-a-4	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	Harz
I-8-a-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	>250

Beispiel I-8-b-1

- 5 Herstellung analog zu Beispiel (I-2-b-1), durch Umsetzung der Verbindung gemäß Beispiel I-8-a-2 mit Isovaleriansäurechlorid. Öl.

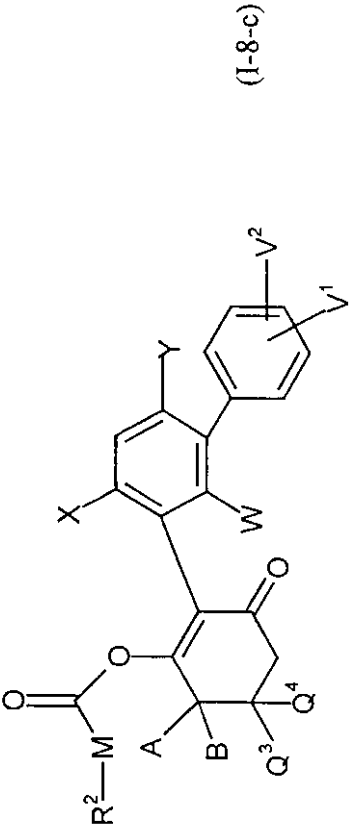
¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): 1,1 (δ, 6H, 2xCHCH₃); 1,1 (s, 6H, 2xCCH₃); 1,65 (m, 1H, CHCH₃); 2,0, 2,2 (s, 6H, ArCH₃); 6,7-7,5 (m, 6H, Ar-H) ppm.

Beispiel I-8-c-1

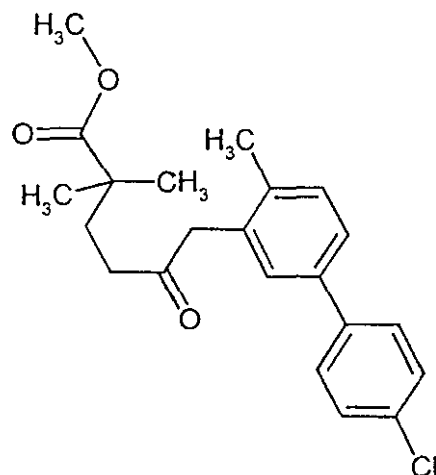
- 5 Herstellung analog zu Beispiel (I-2-c-1), durch Umsetzung der Verbindung gemäß (I-8-a-5) mit Chlorameisensäureethylester.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO): $\delta=1,1$ (t, 3H, CH_2CH_3); 1,14 1,18 (s, 2x3H, C- CH_3);
1,9 2,0 2,1 (s, 3x3H, Ar CH_3); 2,45 2,7 (d, 2x2H, Cyclohexyl- CH_2); 4,1 (q, 2H, OCH_2);
10 7,0 - 7,5 (m, 5H, Ar-H) ppm.

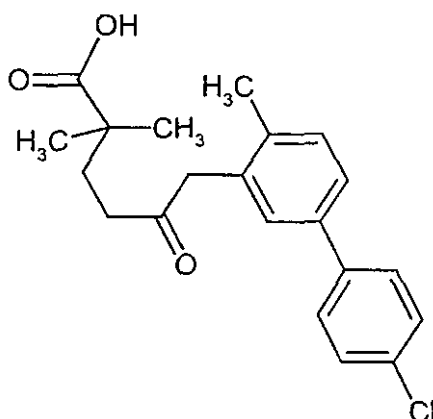
Analog zu Beispiel (1-8-c-1) bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung der Verbindungen der Formel (1-8-c) erhält man folgende Verbindungen



Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Q ³	Q ⁴	M	R ²	Fp.°C
1-8-c -2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	Oel

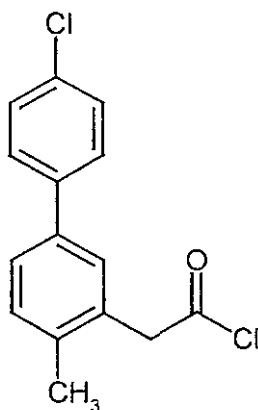
Beispiel XI-1

- 5 38,2 g der Verbindung gemäß Beispiel XLII-1, 14,6 g Kaliumcarbonat und 45,25 g Methyljodid werden in 250 ml Aceton 16 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Man filtriert, engt ein und reinigt den Rückstnad an Kieselgel (Laufmittel Methylenchlorid/Petrolether 2/1, schließlich reines Methylenchlorid. Ausbeute 2,1g Öl.
- 10 ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): 1,1 (s, 6H, 2xCCH₃); 1,7 (m, 2H, COCH₂CH₂); 2,15 (s, 3H, ArCH₃); 2,55 (m, 2H, COCH₂CH₂); 3,55 (s, 3H, OCH₃); 7,2-7,7 (m, 7H, Ar-H) ppm.

Beispiel XLII-1

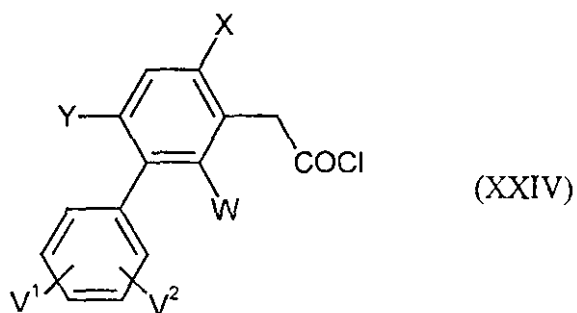
- 5 Zu einer Lösung von 60 ml LDA-Lösung (2 molar, 1,1 eq) in 120 ml THF tropft man bei -15°C eine Lösung von 34 g der Verbindung gemäß Beispiel XXXII-2 in 30 ml THF und rührt noch 1 Stunde bei 0°C. Dann tropft man bei -15°C eine Lösung von 10,3 g 2,2-Dimethylglutarsäureanhydrid in 20 ml THF. Man rührt 2 Stunden bei Raumtemperatur, gibt dann 180 ml Wasser und 48 g Ammoniumchlorid zu, säuert
- 10 mit konzentrierter HCl an und extrahiert das Zwischenprodukt mit Ether. Der Ether wird entfernt und der Rückstand mit 120 ml KOH in 400 ml Wasser zwei Tage unter Rückfluß erhitzt.

- Nach dem Abkühlen säuert man mit konzentrierter HCl an und extrahiert mit Ether.
- 15 Das nach dem Entfernen des Ethers verbleibende Rohprodukt wird ohne Reinigung weiter umgesetzt. Ausbeute 38,4 g Öl.

Beispiel XXIV-1

- 5 65,2 g der Verbindung gemäß Beispiel XXVII-2 werden in 55 ml Thionylchlorid auf 70°C erhitzt, bis die Gasentwicklung beendet ist. Das überschüssige Thionylchlorid wird entfernt und der Rückstand im Hochvakuum destilliert. Ausbeute: 32 g, Fp. 46°C.

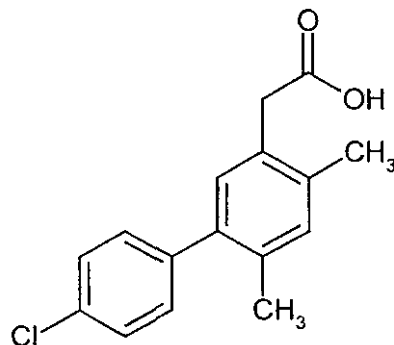
Analog zu Beispiel (XXIV-1) bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung von Verbindungen der Formel (XXIV) erhält man folgende Verbindungen der Formel (XXIV)



5

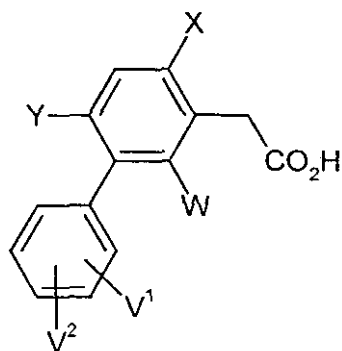
Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	Fp.°C
XXIV-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	*
XXIV-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	*
XXIV-4	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	*

- * Die Verbindungen wurden ohne weitere Reinigung zur Herstellung von Verbindungen der Formel (II) bzw. (III) eingesetzt.

Beispiel XXVII-1

- 5 Zu 35 g der Verbindung gemäß Bsp. XXXII-1 in 280 ml THF tropft man 3,04 g LiOH in 280 ml Wasser, gibt 10 ml Ethanol zu und rührt über Nacht bei Raumtemperatur. Dann wird eingengt, der Rückstand mit Wasser versetzt und mit MTBE extrahiert. Die wässrige Phase wird mit konzentrierter HCl angesäuert. Man saugt ab und wäscht mit Hexan nach. Ausbeute: 21 g, Fp. 133°C.

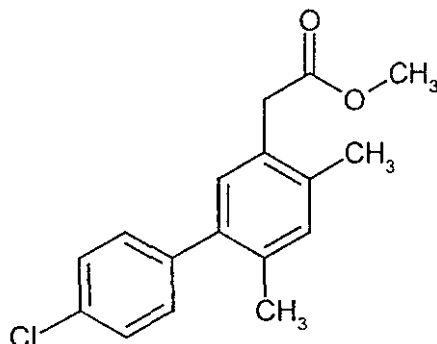
Analog zu Beispiel (XXVII-1) bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung von Verbindungen der Formel (XXVII) erhält man folgende Verbindungen der Formel (XXVII)



(XXVII)

5

Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	Fp.°C
XXVII-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	137
XXVII-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	138
XXVII-4	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	134
XXVII-5	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	153

Beispiel XXXII-1

5 Variante A

Zu 31 g KOH in 1 l Methanol gibt man 54 g der Verbindung gemäß Beispiel XLV-1 und rührt über Nacht bei Raumtemperatur. Man saugt ab und wäscht mit Methanol nach. Das Filtrat wird eingeeengt, der Rückstand mit Wasser versetzt und mit Methylenchlorid extrahiert. Die organische Phase wird eingeeengt. Ausbeute 10 g.

10

Variante B

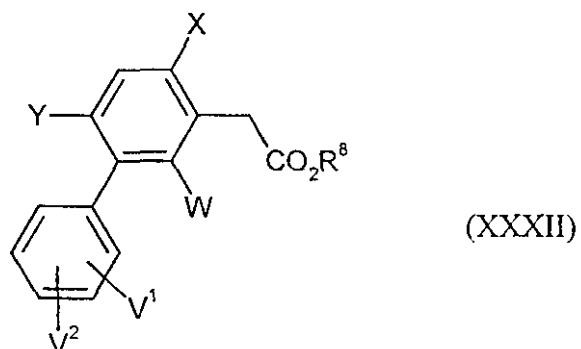
96 g 3-Brom-4,6-dimethylphenylessigsäure-methylester, 65 g 4-Chlorphenylboronsäure und 1,5 g Bis(triphenylphosphin)palladium(II)chlorid in 1 l Dimethoxyethan und 700 ml 1 M Na₂CO₃-Lösung werden über Nacht unter Rückfluß erhitzt. Man verteilt zwischen Wasser und EE, wäscht die organische Phase mit gesättigter Ammoniumchloridlösung, Wasser und gesättigter Kochsalzlösung und engt ein. Ausbeute 61 g.

15

20

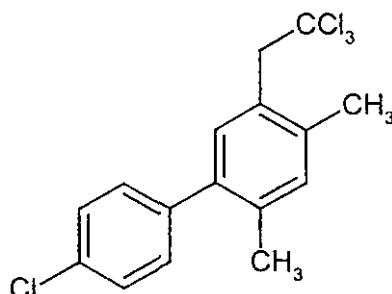
¹H-NMR (400 MHz, COCl₃): δ= 2,21, 2,31 (2s, 6H, Ar-CH₃); 3,63 (s, 2H, CH₂); 3,69 (s, 3H, OCH₃); 7,03-7,1 (2s, 2H, Ar-H); 7,25, 7,38 (AA', BB', 4H, Ar-H) ppm.

Analog zu Beispiel (XXXII-1), Variante B bzw. gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung von Verbindungen der Formel (XXXII) erhält man folgende Verbindungen der Formel (XXXII)

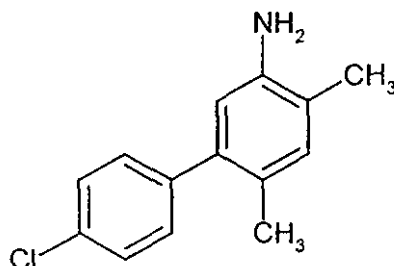


5

Bsp.-Nr.	W	X	Y	V ¹	V ²	R ⁸	Fp. °C
XXXII-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	CH ₃	Öl
XXXII-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	CH ₃	68
XXXII-4	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	CH ₃	Öl
XXXII-5	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	CH ₃	Öl

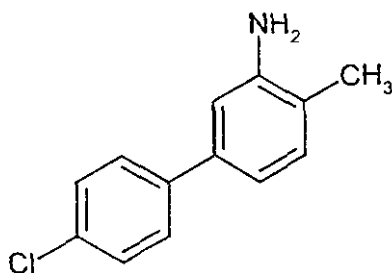
Beispiel XLV-1

- 5 29,5 g wasserfreies Kupfer(II)chlorid werden in die Lösung von 33 g Isopentylnitrit in 120 ml Acetonitril eingetragen. Man versetzt mit 271 g Dichlorethen (Vinylidenchlorid) und anschließend mit 43g der Verbindung gemäß Beispiel XLVI-1 gelöst in Acetonitril und rührt bei Raumtemperatur bis zum Ende der Gasentwicklung. Dann gießt man auf 800 ml eisgekühlte 20%ige Salzsäure und extrahiert mehrfach mit
- 10 MTBE. Die organische Phase wird mit 20%iger HCl gewaschen und eingengt. Ausbeute 19 g. Wurde ohne Reinigung direkt weiter umgesetzt.

Beispiel XLVI-1

- 5 erhält man ausgehend von 3-Brom-4,6-dimethylanilin und 4-Chlorphenylboronsäure durch Suzuki-Kupplung, die wie bei Beispiel XXXII-1, Variante B durchgeführt wird. Ausbeute 12 g.

10 $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): $\delta = 2,12$ (s, 3H, Ar- CH_3), 2,18 (s, 3H, Ar- CH_3), 3,35 (br, 2H, NH_2), 6,53 (s, 1H, Ar-H), 6,94 (s, 1H, Ar-H), 7,23 (AA',BB', 2H, Ar-H), 7,35 (AA',BB', 2H, Ar-H).

Beispiel XLVI-2

15

wird analog ausgehend von 3-Brom-6-methylanilin erhalten. Fp. 184°C

Beispiel**Myzus-Test**

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

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

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

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

20 Bei diesem Test zeigt z.B. die folgende Verbindung der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

Tabelle

pflanzenschädigende Insekten

Myzus-Test

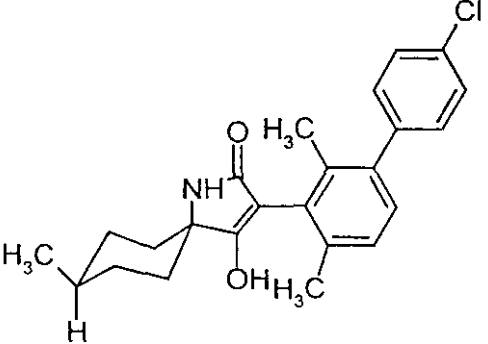
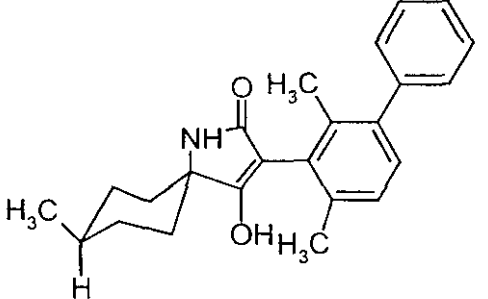
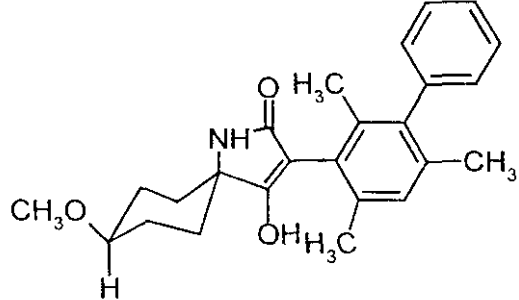
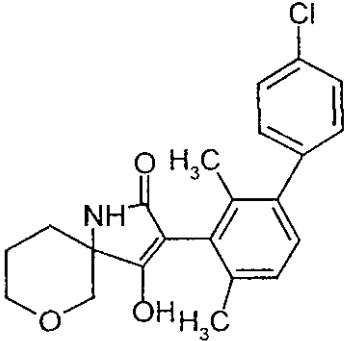
Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 6 Tagen
Bsp. I-1-a-3 	0,1	98
Bsp. I-1-a-2 	0,1	95
Bp. I-1-a-6 	0,1	100

Tabelle - Fortsetzung

pflanzenschädigende Insekten

Myzus-Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 6 Tagen
Bsp. I-1-a-7 	0,1	98

Beispiel**Phaedon-Larven-Test**

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

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

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

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

20 In diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

Tabelle

pflanzenschädigende Insekten

Phaedon-Larven-Test

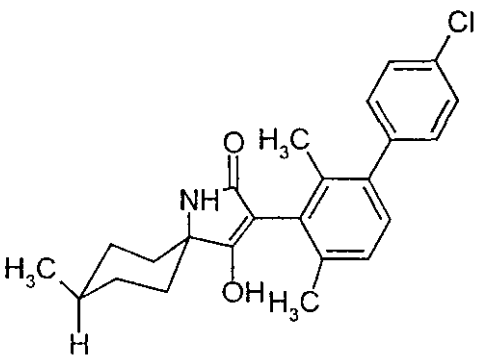
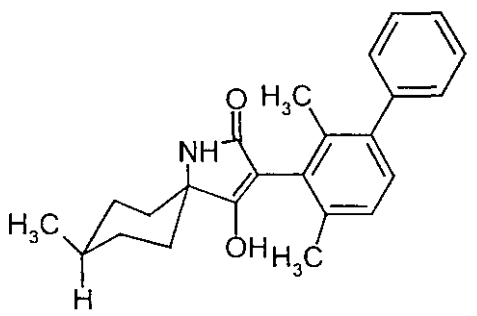
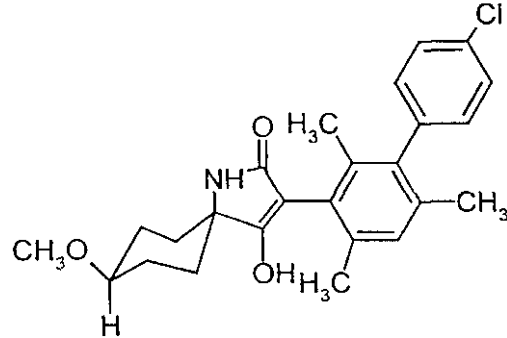
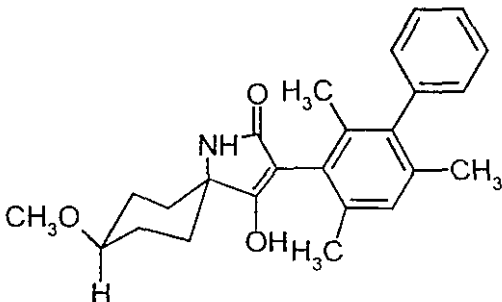
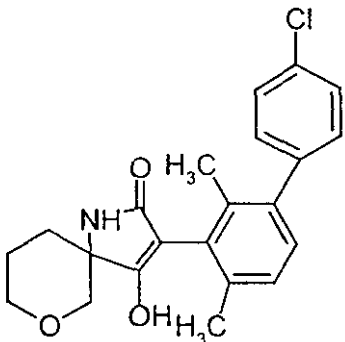
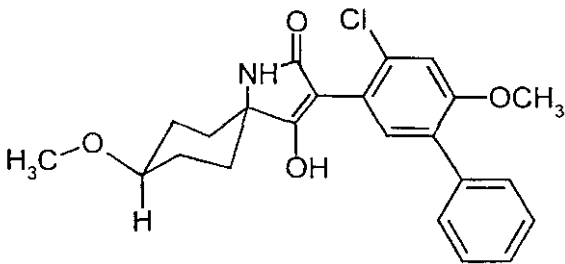
Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
Bsp. I-1-a-3 	0,1	100
Bsp. I-1-a-2 	0,1	100
Bsp. I-1-a-5 	0,1	100

Tabelle - Fortsetzung

pflanzenschädigende Insekten

Phaedon-Larven-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
<p>Bsp. I-1-a-6</p> 	0,1	100
<p>Bsp. I-1-a-7</p> 	0,1	100
<p>Bsp. I-1-a-13</p> 	0,1	100

Beispiel**Spodoptera frugiperda-Test**

- 5 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

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

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

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

20 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit.

Tabelle

pflanzenschädigende Insekten

Spodoptera frugiperda-Test

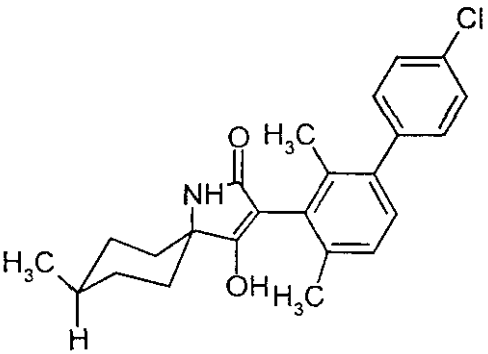
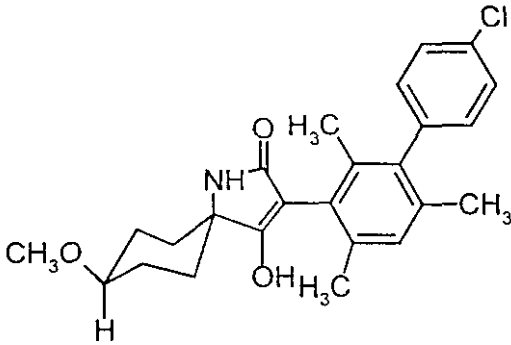
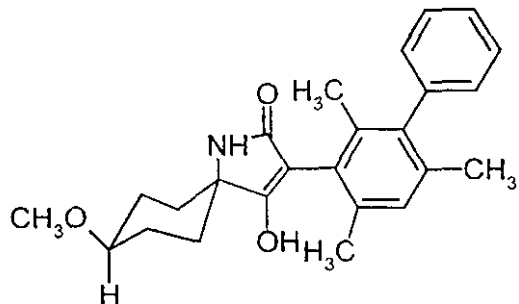
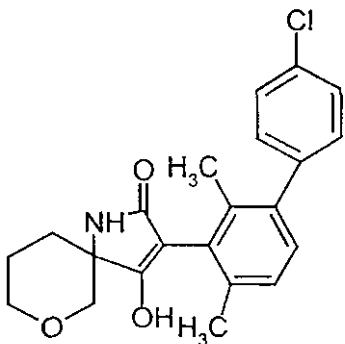
Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
Bsp. I-1-a-3 	0,1	100
Bsp. I-1-a-5 	0,1	100
Bsp. I-1-a-6 	0,1	100

Tabelle - Fortsetzung

pflanzenschädigende Insekten

Spodoptera frugiperda-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkon- zentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
Bsp. 1-1-a-7 	0,1	100

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

- 5 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

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

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

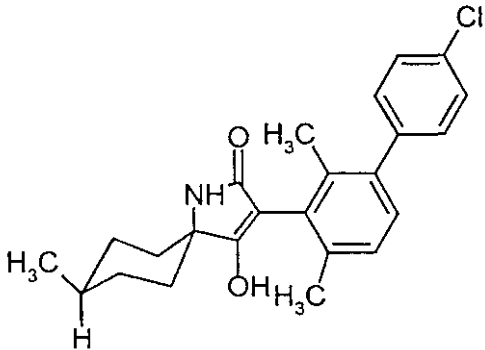
Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Spinnmilben abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Spinnmilben abgetötet wurden.

20 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

Tabelle

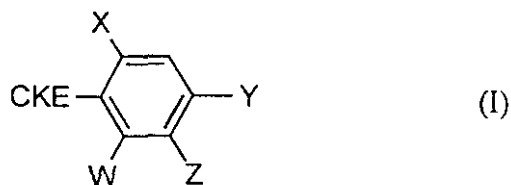
pflanzenschädigende Insekten

Tetranychus-Test (OP-resistent/Tauchbehandlung)

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
<p>Bsp. I-1-a-3</p> 	0,1	100

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel (I)



5 in welcher

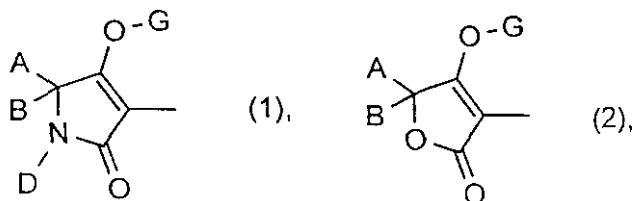
X für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Nitro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylalkoxy oder Phenylalkylthio steht,

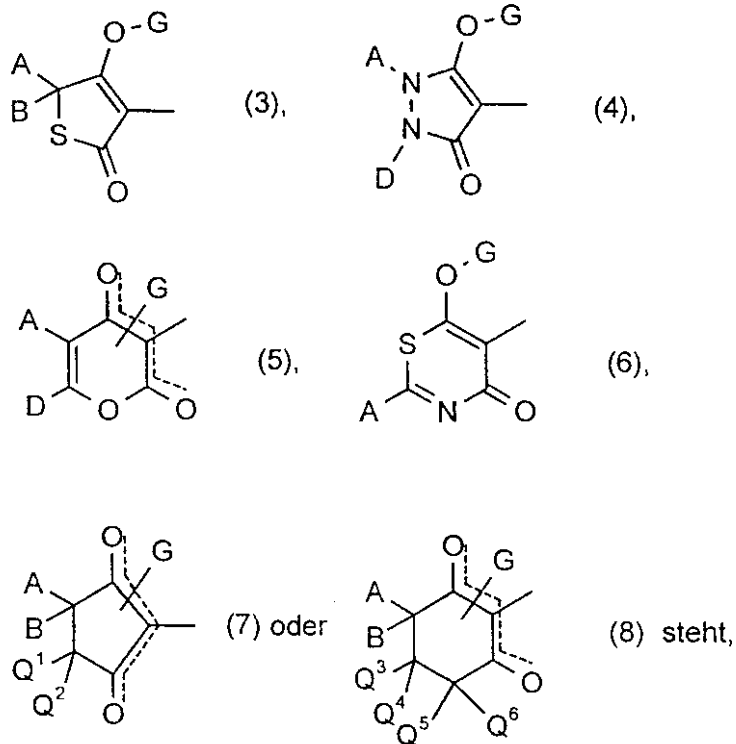
10

Z für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Aryl oder Hetaryl steht,

15 W und Y unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Nitro oder Cyano stehen,

20 CKE für eine der Gruppen





worin

5

A für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls mindestens ein Ringatom durch ein Heteroatom ersetzt ist, oder

10

jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,

B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, oder

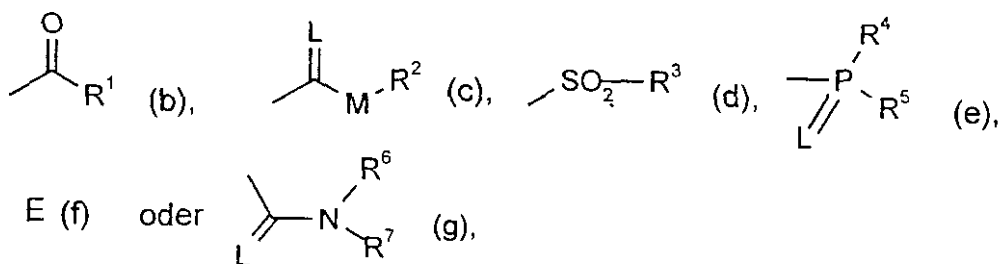
15

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

- 5 D für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eines oder mehrere Ringglieder durch Heteroatome ersetzt sind, Arylalkyl, Aryl, Hetarylalkyl oder Hetaryl steht oder
- 10 A und D gemeinsam mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen gesättigten oder ungesättigten und gegebenenfalls mindestens ein (im Falle CKE = (4) weiteres) Heteroatom enthaltenden, im A,D-Teil unsubstituierten oder substituierten Ring stehen, bzw.
- 15 A und Q¹ gemeinsam für jeweils gegebenenfalls durch jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Hydroxy, Alkoxy, Alkylthio, Cycloalkyl, Benzyloxy oder Aryl substituiertes Alkandiyl oder Alkendiyl stehen oder
- 20 Q¹ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- Q², Q⁴, Q⁵ und Q⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Alkyl stehen,
- 25 Q³ für Wasserstoff, Alkyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl (worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist) oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht, oder
- 30 Q³ und Q⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten, gegebenenfalls

ein Heteroatom enthaltenden unsubstituierten oder substituierten Ring stehen,

G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



steht,

worin

E für ein Metallion oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht,

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R^1 für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl oder Alkoxy substituiertes Cycloalkyl, das durch mindestens ein Heteroatom unterbrochen sein kann, jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenylalkyl, Hetaryl, Phenoxyalkyl oder Hetaryloxyalkyl steht,

R^2 für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl oder für

jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl,
Phenyl oder Benzyl steht,

5 R³, R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylthio, Alkenylthio, Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenoxy oder Phenylthio stehen,

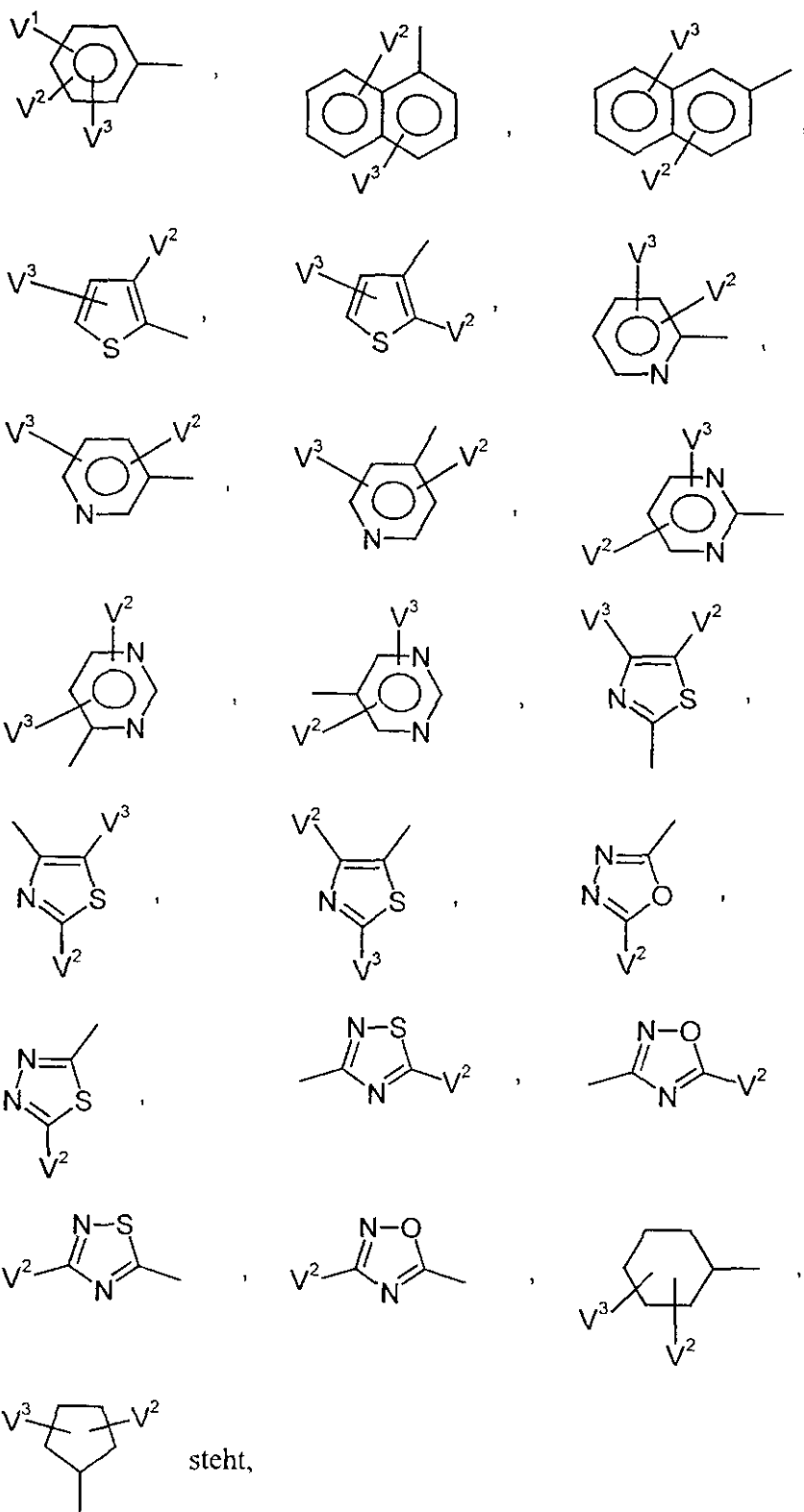
10 R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, jeweils
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl,
Cycloalkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, für gegebe-
nenfalls substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls
substituiertes Benzyl stehen, oder gemeinsam mit dem
15 N-Atom, an das sie gebunden sind, für einen gege-
benenfalls durch Sauerstoff oder Schwefel unterbroche-
nen Cyclus stehen.

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

20 X für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-
C₆-Alkenyloxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-
Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, Ni-
tro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl,
25 C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro
oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyloxy
oder Benzylthio steht,

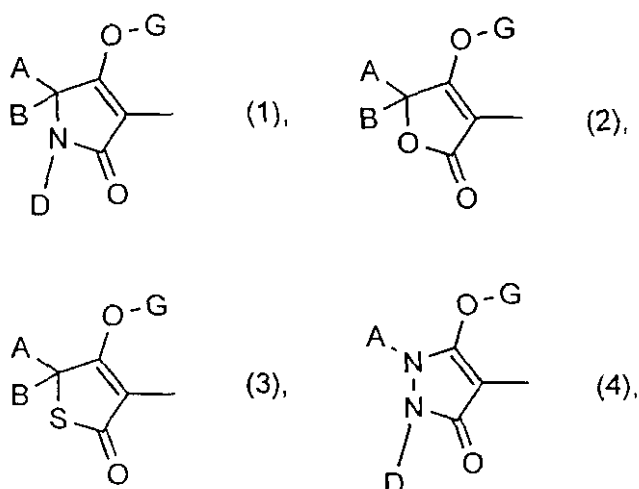
Z für einen der Reste

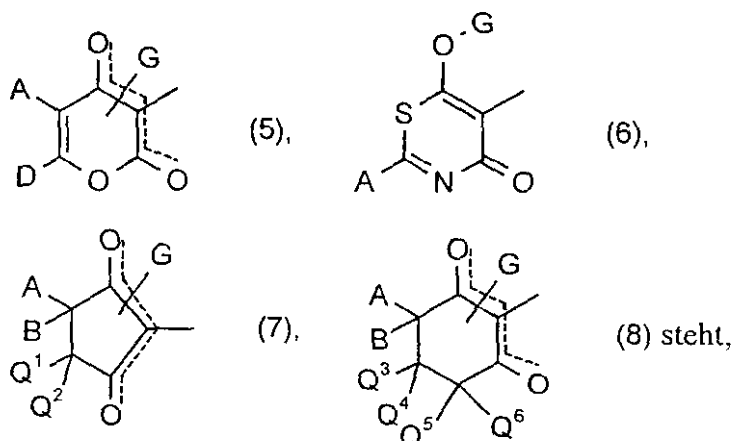
30



- V¹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkylthio steht,
- 10 V² und V³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy stehen,
- 15 W und Y unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano stehen,

CKE für eine der Gruppen



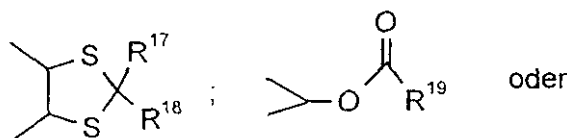
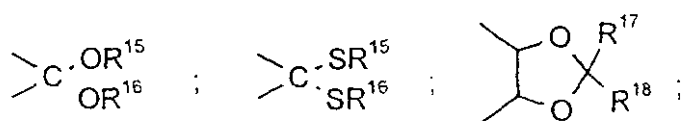
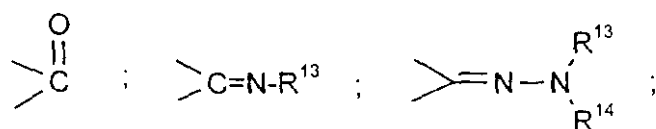


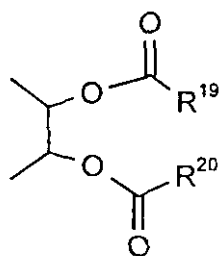
- 5 A für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind oder für jeweils gegebenenfalls durch
- 10 Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes C₆- oder C₁₀-Aryl, Hetaryl mit 5 oder 6 Ringatomen oder C₆- oder C₁₀-Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,
- 15 B für Wasserstoff, C₁-C₁₂-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl steht oder
- 20 A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₃-C₁₀-Cycloalkyl oder ungesättigtes C₅-C₁₀-Cycloalkyl stehen, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welche gegebenenfalls einfach oder zweifach durch C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, Halogen oder Phenyl substituiert sind oder

- 5 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₃-C₆-Cycloalkyl stehen, welches durch eine gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthaltende Alkylendiyl-, oder durch eine Alkylendioxy- oder durch eine Alkylendithiyl-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- bis achtegliedrigen Ring bildet oder
- 10 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₅-C₈-Cycloalkenyl stehen, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder Halogen substituiertes C₂-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl oder
- 15 C₄-C₆-Alkandiendiyl stehen, worin gegebenenfalls eine Methylen-Gruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,
- 20 D für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Hetaryl mit 5 oder 6 Ring-
- 25 atomen, Phenyl-C₁-C₆-alkyl oder Hetaryl-C₁-C₆-alkyl mit 5 oder 6 Ringatomen steht, oder

A und D gemeinsam für jeweils gegebenenfalls substituiertes C₃-C₆-Alkandiyl oder C₃-C₆-Alkendiyl stehen, in welchen gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und wobei als Substituenten jeweils in Frage kommen:

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

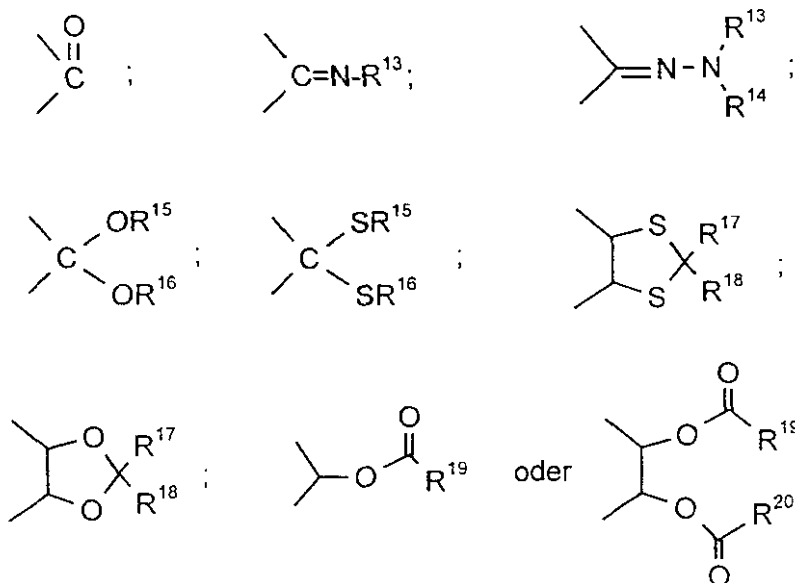




enthalten ist, oder

- 5 A und Q¹ gemeinsam für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, durch jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₇-Cycloalkyl oder durch
- 10 jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes Benzyloxy oder Phenyl substituiertes C₃-C₆-Alkandiyl oder C₄-C₆-Alkendiyl stehen, welches außerdem gegebenenfalls eine der nachstehenden Gruppen

15



enthält oder durch eine C₁-C₂-Alkandiylgruppe oder durch ein Sauerstoffatom überbrückt ist oder

Q¹ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht,

5

Q², Q⁴, Q⁵ und Q⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl stehen,

Q³ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₂-alkyl, gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl steht oder

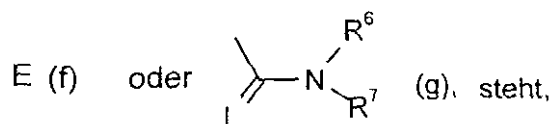
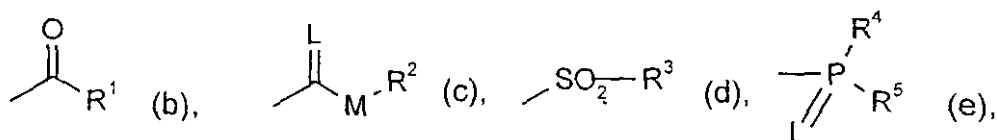
10

15

Q³ und Q⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituierten C₃-C₇-Ring stehen, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

20

G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



in welchen

25

E für ein Metallion oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

5

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

10

15

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

20

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

25

für gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiertes 5- oder 6-gliedriges Hetaryl,

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

30

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

- R² für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl,
- 5 für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl oder
- 10 für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
- R³ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
- 15
- R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylamino, Di-(C₁-C₈-alkyl)amino, C₁-C₈-Alkylthio, C₂-C₈-Alkenylthio, C₃-C₇--Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio stehen,
- 20
- R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Phenyl, gegebenenfalls durch
- 25
- 30 Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Benzyl oder zusammen für einen gegebenenfalls durch

C₁-C₄-Alkyl substituierten C₃-C₆-Alkylenrest stehen, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

5 R¹³ für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist, oder für jeweils
10 gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkoxy steht,

15 R¹⁴ für Wasserstoff oder C₁-C₈-Alkyl steht oder

R¹³ und R¹⁴ gemeinsam für C₄-C₆-Alkandiyl stehen,

R¹⁵ und R¹⁶ gleich oder verschieden sind und für C₁-C₆-Alkyl stehen oder

20 R¹⁵ und R¹⁶ gemeinsam für einen C₂-C₄-Alkandiylrest stehen, der gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder durch gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl substituiert ist,

25 R¹⁷ und R¹⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl stehen
30 oder

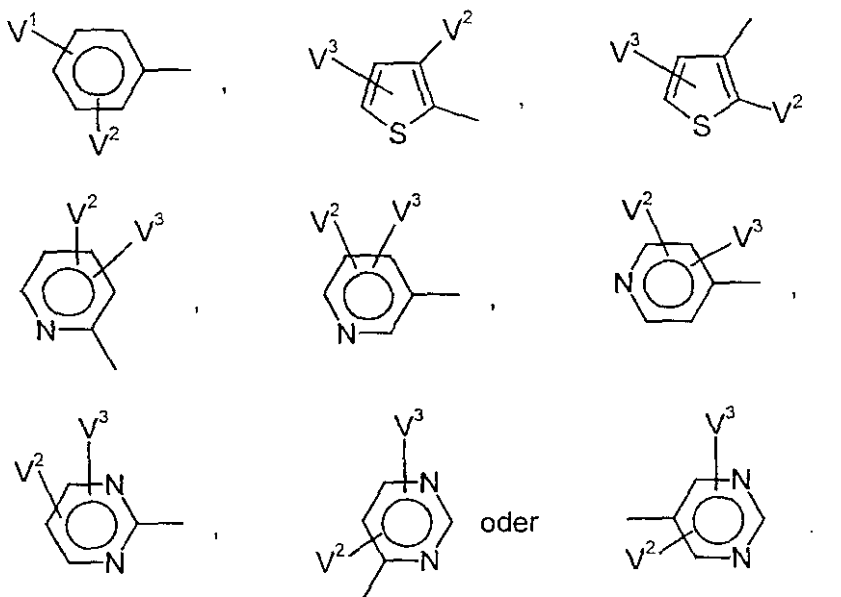
R¹⁷ und R¹⁸ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für eine Carbonylgruppe oder für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₅-C₇-Cycloalkyl stehen, in dem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und

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

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

X für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyloxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₄-Halogenalkenyloxy, Nitro oder Cyano stehe,

Z für einen der Reste

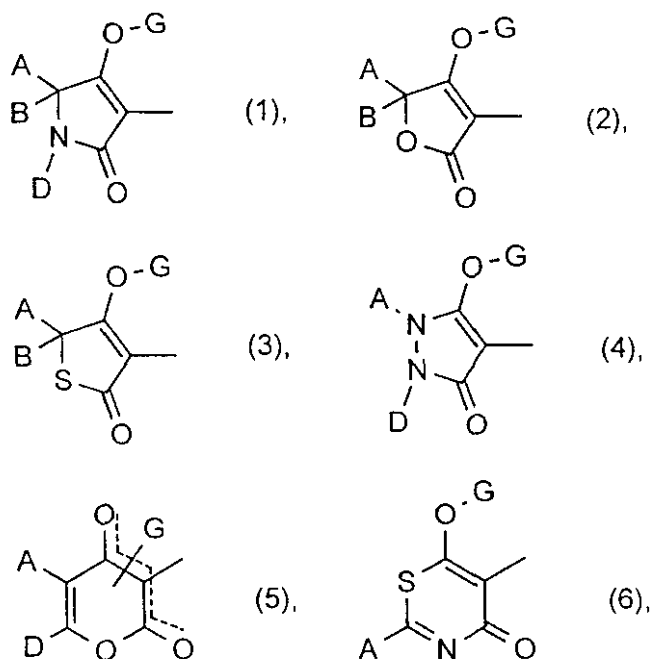


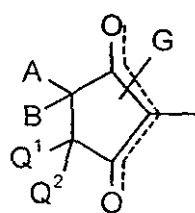
V¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano oder jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,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

V² und V³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy stehen,

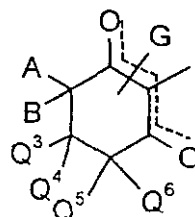
W und Y unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy stehen,

CKE für eine der Gruppen





(7),



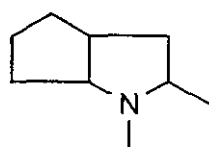
(8) steht,

- 5 A für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder (jedoch nicht im Fall der Verbindungen der Formeln (I-5), (I-7) und (I-8)) jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl, Furanyl, Pyridyl, Imidazolyl, Triazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Thiazolyl, Thienyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl steht,
- 10
- 15 B für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht oder
- A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes oder ungesättigtes C₅-C₇-Cycloalkyl stehen, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch C₁-C₆-Alkyl, C₅-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Fluor, Chlor oder Phenyl substituiert ist oder
- 20
- A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₅-C₆-Cycloalkyl stehen, welches durch eine gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Sauerstoff- oder Schwefelatome enthaltende Alkylendiyl- oder durch eine Alkylendioxy- oder durch eine Alkylenedithiol-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das
- 25

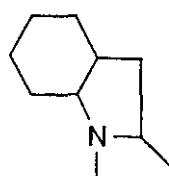
sie gebunden ist, einen weiteren fünf- oder sechsgliedrigen Ring bildet oder

- 5 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl stehen, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₅-Alkoxy, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes C₂-C₄-Alkandiyl oder C₂-C₄-Alkendiyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch
- 10 Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für Butadiendiyl stehen,
- 15 D für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl oder C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder (jedoch nicht im Fall der Verbindungen der Formeln (I-1) und (I-4)) für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl,
- 20 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl, Furanyl, Imidazolyl, Pyridyl, Thiazolyl, Pyrazolyl, Pyrimidyl, Pyrrolyl, Thienyl, Triazolyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl steht, oder
- 25 A und D gemeinsam für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₅-Alkandiyl stehen, in welchem eine Methylengruppe durch eine Carbonylgruppe, Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein kann, wobei als Substituenten Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy in Frage kommen oder

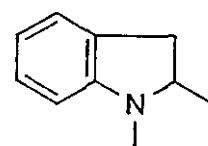
A und D (im Fall der Verbindungen der Formel (I-1)) gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für eine der Gruppen AD-1 bis AD-10:



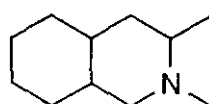
AD-1



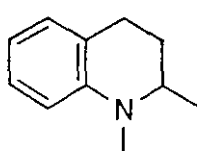
AD-2



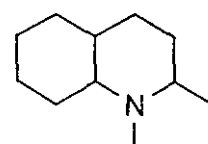
AD-3



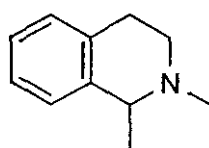
AD-4



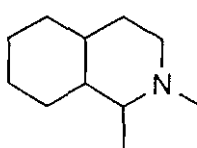
AD-5



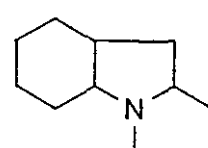
AD-6



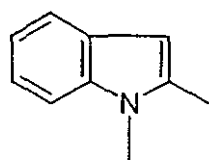
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

stehen,

5

oder

A und Q¹ gemeinsam für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, durch jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl oder C₃-C₄-Alkendiyl stehen oder

10

Q¹ für Wasserstoff steht,

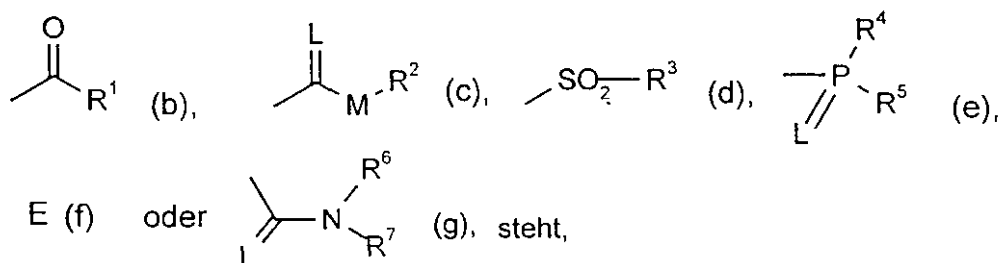
Q² für Wasserstoff steht,

5 Q⁴, Q⁵ und Q⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl stehen,

10 Q³ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₂-alkyl oder gegebenenfalls durch Methyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl steht, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder

15 Q³ und Q⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten gesättigten C₅-C₆-Ring stehen, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

20 G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



in welchen

25 E für ein Metallion oder ein Ammoniumion steht,

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

- 5 R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, Poly-C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₅-Alkyl oder C₁-C₅-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder
- 10 zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind,
- für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy,
- 15 C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Phenyl,
- für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl oder C₁-C₃-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl-C₁-C₄-alkyl,
- 20 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Pyrazolyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Furanyl oder Thienyl,
- 25 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Phenoxy-C₁-C₃-alkyl oder
- für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Amino oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Pyridyloxy-C₁-C₃-alkyl, Pyrimidyloxy-C₁-C₃-alkyl oder Thiazolyloxy-C₁-C₃-alkyl steht,
- 30

- R² für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl oder Poly-C₁-C₆-alkoxy-C₂-C₆-alkyl,
- 5 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl oder
- für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl oder C₁-C₃-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
- 10
- R³ für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy, Cyano oder
- 15 Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
- R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₄-Alkenylthio, C₃-C₆-Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls
- 20 durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Halogenalkylthio, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio stehen und
- R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, für
- 25 gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Benzyl, oder zusammen
- 30 für einen gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl substituierten C₄-

C₅-Alkylenrest stehen, in welchem gegebenenfalls eine Methylen-
gruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

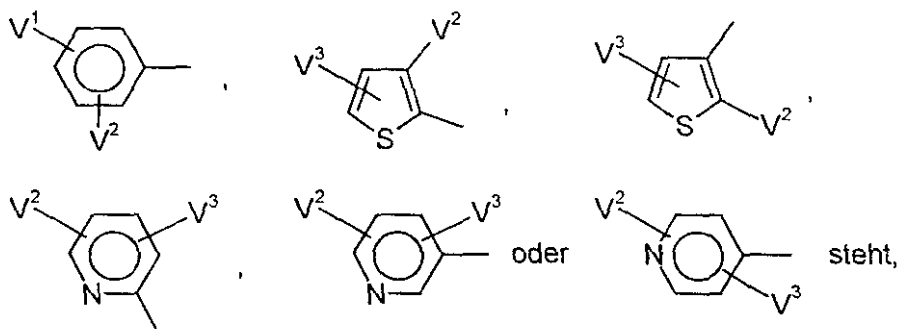
4. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, worin

5

X für Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Nitro oder Cyano steht,

10

Z für einen der Reste



15

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

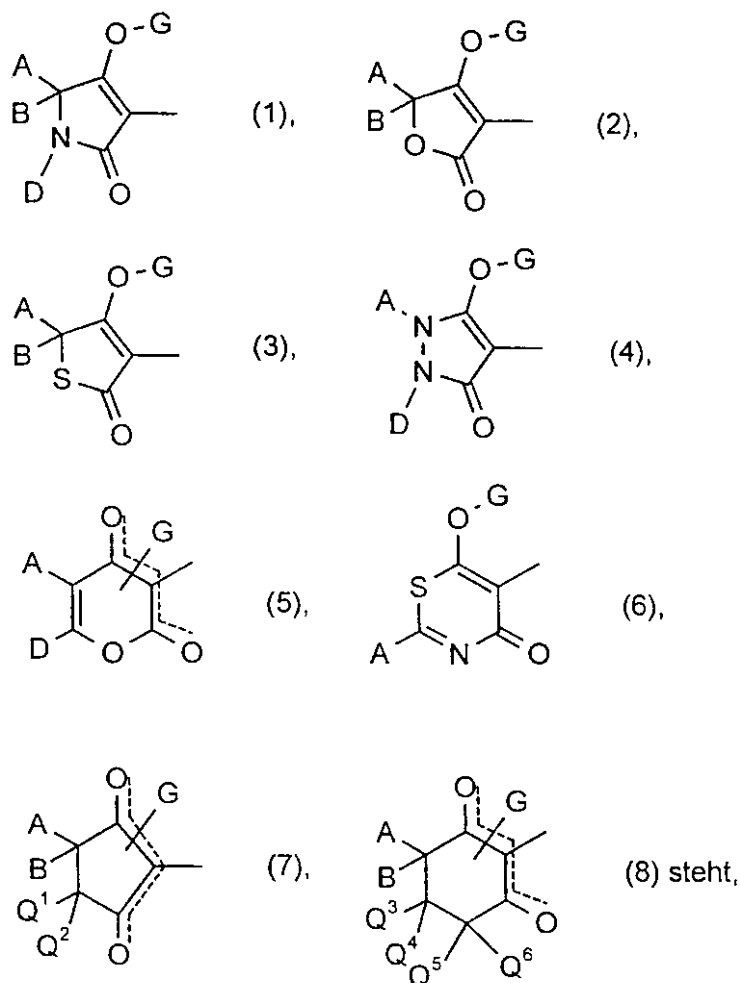
20

V² und V³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy stehen,

25

W und Y unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Methoxy, Ethoxy oder Propoxy stehen,

CKE für eine der Gruppen



5

10

15

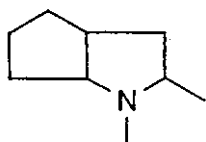
A für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, gegebenenfalls durch Fluor, Methyl, Ethyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder (jedoch nicht im Fall der Verbindungen der Formeln (I-5), (I-7) und (I-8)) für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

B für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht oder

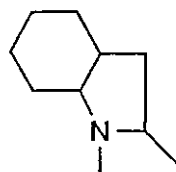
- 5 A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₅-C₆-Cycloalkyl stehen, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, iso-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Propoxy, iso-Propoxy, Butoxy, iso-Butoxy, sek.-Butoxy, tert.-Butoxy, Fluor oder Chlor substituiert ist oder
- 10 A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₅-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl, worin zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für C₂-C₄-Alkandiyl oder C₂-C₄-Alkendiyl, worin jeweils gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder
- 15 für Butadiendiyl stehen,
- 20 D für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder (jedoch nicht im Fall der Verbindungen der Formeln (I-1) und (I-4)) für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl, Furanyl, Pyridyl, Thienyl
- 25 oder Benzyl steht,
- oder
- 30 A und D gemeinsam für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl stehen, worin gegebenenfalls ein Kohlenstoffatom durch Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls durch Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiert ist oder

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

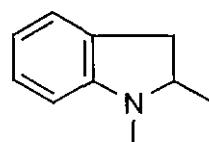
5



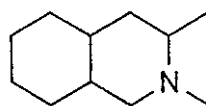
AD-1



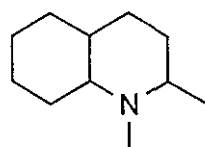
AD-2



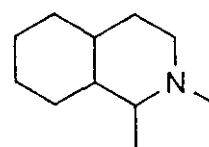
AD-3



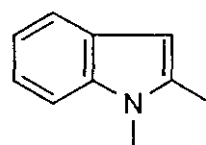
AD-4



AD-6



AD-8



AD-10

stehen,

A und Q¹ gemeinsam für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Hydroxy, Methyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₄-Alkandiyyl oder Butendiyyl stehen oder

10

Q¹ für Wasserstoff steht,

Q² für Wasserstoff steht,

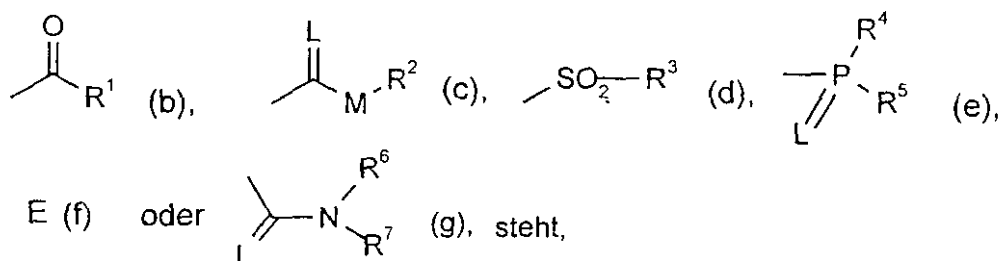
15

Q⁴, Q⁵ und Q⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl stehen,

Q³ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl steht, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder

5 Q³ und Q⁴ gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an den sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch Methyl oder Methoxy substituierten gesättigten C₅-C₆-Ring stehen, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

10 G für Wasserstoff (a) oder für eine der Gruppen



in welchen

E für ein Metallion oder ein Ammoniumion steht,

15

L für Sauerstoff oder Schwefel steht und

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

20 R¹ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, Poly-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy oder iso-Propoxy
25 substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder

zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind,

5 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Phenyl,

10 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Benzyl,

15 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Furanyl, Thienyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Thiazolyl oder Pyrazolyl,

für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Phenoxy-C₁-C₂-alkyl oder

20 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Amino, Methyl oder Ethyl substituiertes Pyridyloxy-C₁-C₂-alkyl, Pyrimidyloxy-C₁-C₂-alkyl oder Thiazolyloxy-C₁-C₂-alkyl steht,

25 R² für jeweils gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl oder Poly-C₁-C₄-alkoxy-C₂-C₆-alkyl,

30 für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl oder Methoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl,

oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

5 R^3 für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, tert.-Butyl, Methoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

10 R^4 und R^5 unabhängig voneinander für C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, C_1 - C_4 -Alkylthio oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C_1 - C_2 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Fluoralkoxy, C_1 - C_2 -Alkylthio, C_1 - C_2 -Fluoralkylthio oder C_1 - C_3 -Alkyl substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio
15 stehen und

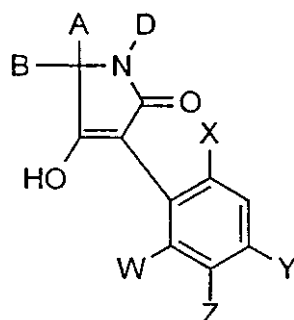
R^6 und R^7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, für C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_3 - C_4 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls
20 durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy substituiertes Benzyl, oder zusammen für einen C_5 - C_6 -Alkylenrest stehen, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

25

5. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man

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

30



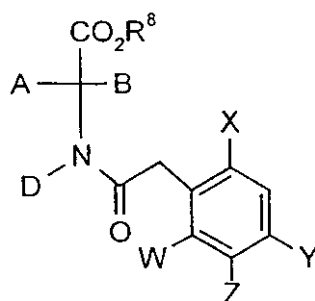
(I-1-a)

in welcher

A, B, D, W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen
haben,

erhält, wenn man

N-Acylaminosäureester der Formel (II)



(II)

in welcher

A, B, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

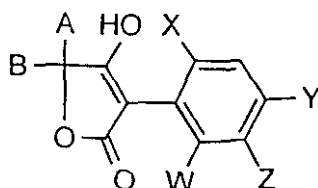
und

R^8 für Alkyl steht,

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

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

5



(I-2-a)

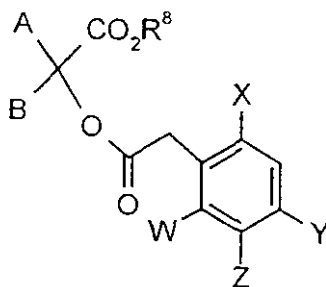
in welcher

A, B, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

erhält, wenn man

Carbonsäureester der Formel (III)



(III)

15

in welcher

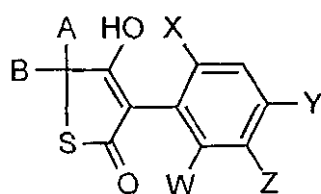
A, B, W, X, Y, Z und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

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

(C) Verbindungen der Formel (I-3-a)

- 235 -



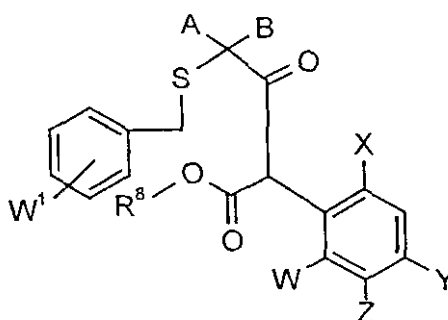
(I-3-a)

in welcher

5

A, B, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man

 β -Ketocarbonsäureester der Formel (IV)

(IV)

10

in welcher

A, B, W, X, Y, Z und R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben
und

15

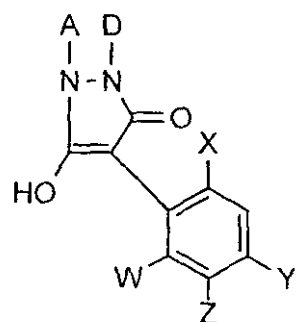
W^1 für Wasserstoff, Halogen, Alkyl oder Alkoxy steht,

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

20

(D) Verbindungen der Formel (I-4-a)

- 236 -



(I-4-a)

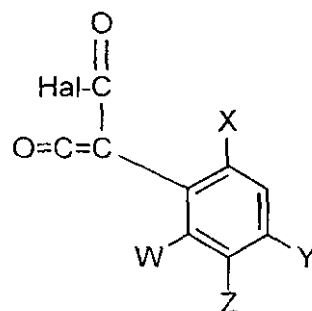
in welcher

A, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

erhält, wenn man

(α) Halogencarbonylketene der Formel (V)



(V)

10

in welcher

W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben

und

15

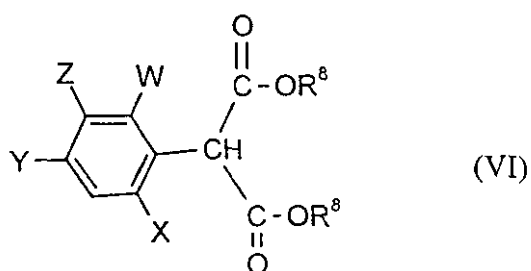
Hal für Halogen steht,

oder

20

(β) Malonsäurederivate der Formel (VI)

- 237 -



in welcher

5 R^8 , W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydrazinen der Formel (VII)



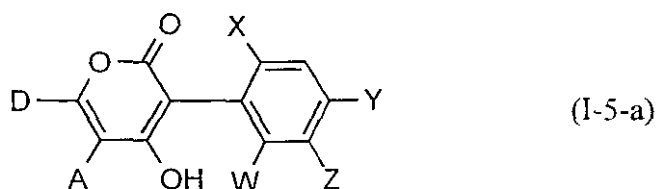
10

in welcher

A und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

(E) Verbindungen der Formel (I-5-a)



20

in welcher

A, D, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man

Carbonylverbindungen der Formel (VIII)

5

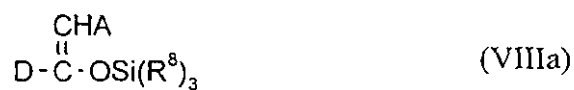


in welcher

A und D die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

oder deren Silylenolether der Formel (VIIIa)

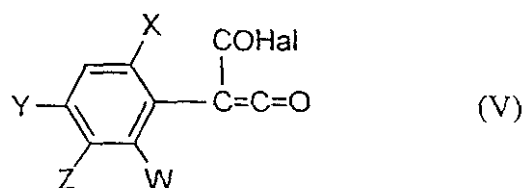


in welcher

15

A, D und R^8 die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Ketensäurehalogeniden der Formel (V)



20

in welcher

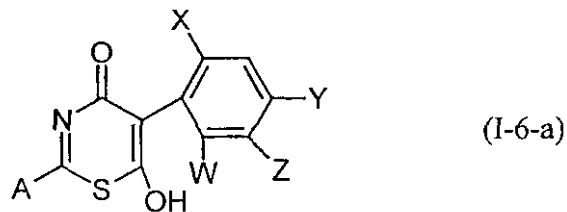
W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Halogen steht,

25

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

(F) Verbindungen der Formel (I-6-a)



5

in welcher

A, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

10

erhält, wenn man Thioamide der Formel (IX)

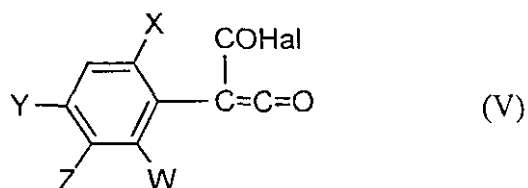


in welcher

A die oben angegebene Bedeutung hat,

15

mit Ketensäurehalogeniden der Formel (V)



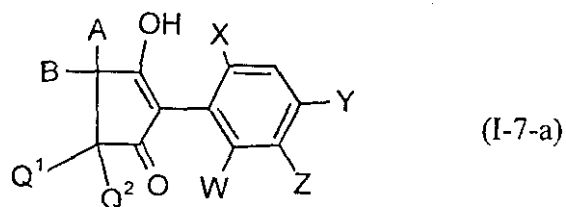
in welcher

20

Hal, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

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

(G) Verbindungen der Formel (I-7-a)

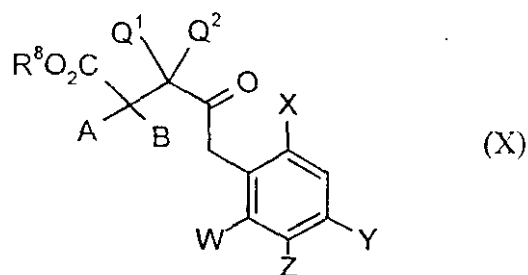


5 in welcher

A, B, Q¹, Q², W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

10 erhält, wenn man

Ketocarbonsäureester der Formel (X)



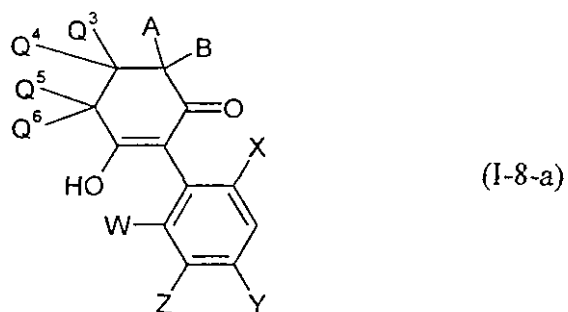
15 in welcher

A, B, Q¹, Q², W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben,
und

20 R⁸ für Alkyl steht,

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

(H) daß man Verbindungen der Formel (I-8-a)

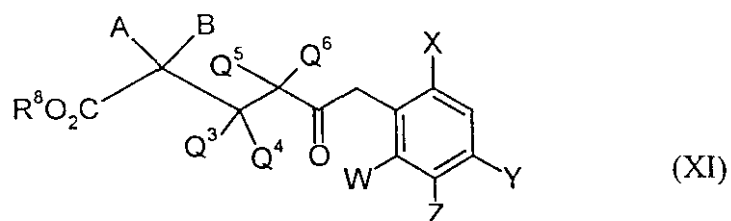


5 in welcher

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene
Bedeutung haben,

10 erhält, wenn man

6-Aryl-5-keto-hexansäureester der Formel (XI)



15 in welcher

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung
haben

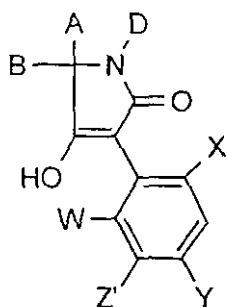
20 und

R⁸ für Alkyl steht,

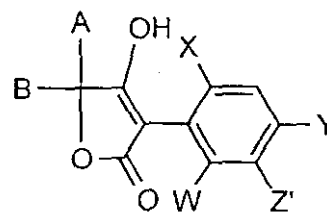
in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert,

- 5 (I) Verbindungen der oben gezeigten Formeln (I-8-a), in welchen A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formel (I-1'-a) bis (I-8'-a),

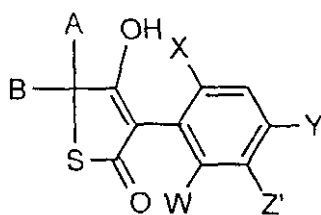
(I-1'-a):



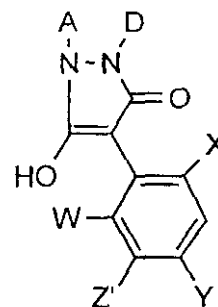
(I-2'-a):



(I-3'-a):



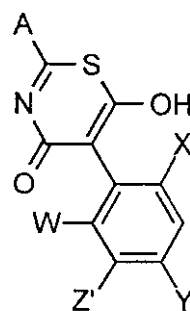
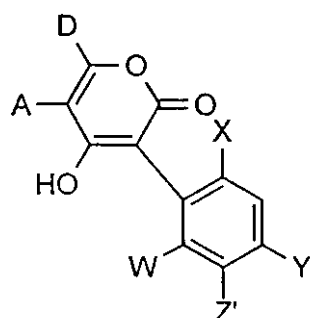
(I-4'-a):



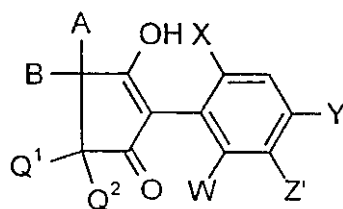
(I-5'-a):

(I-6'-a):

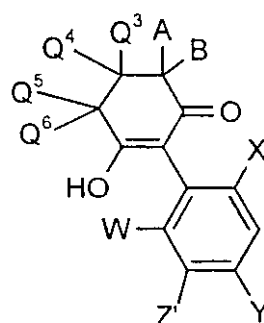
- 243 -



(I-7'-a):



(I-8'-a):



in welchen

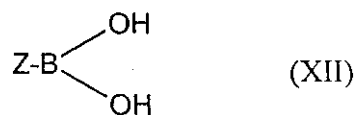
A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X und Y die oben angegebene
Bedeutung haben und

5

Z' für Chlor, Brom oder Jod steht,

mit Boronsäuren der Formel (XII)

10



in welcher

Z die oben angegebene Bedeutung hat,

15

in Gegenwart eines Lösungsmittels, einer Base und eines Katalysators umgesetzt und anschließend gegebenenfalls die so erhaltenen Verbindungen der Formeln (I-1-a) bis (I-8-a) jeweils

- 5 (J α) mit Säurehalogeniden der Formel (XIII)



in welcher

- 10 R¹ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat und

Hal für Halogen steht

oder

- 15 (B) mit Carbonsäureanhydriden der Formel (XIV)



- 20 in welcher

R¹ die oben angegebene Bedeutung hat,

- 25 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt, oder jeweils

- (K) mit Chlorameisensäureestern oder Chlorameisensäurethioestern der Formel (XV)



in welcher

- 5 R^2 und M die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
 enfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt, oder jeweils

- 10 (L) mit Chlormonothioameisensäureestern oder Chlordithioameisensäure-
 estern der Formel (XVI)



in welcher

- 15 M und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
 enfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt, oder jeweils

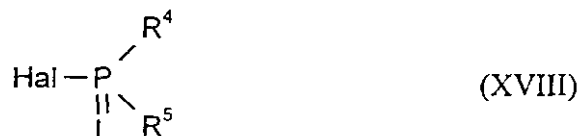
- 20 (M) mit Sulfonsäurechloriden der Formel (XVII)



in welcher

- 25 R^3 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat,
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
 enfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt, oder jeweils

(N) mit Phosphorverbindungen der Formel (XVIII)



in welcher

5

L, R⁴ und R⁵ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben
und

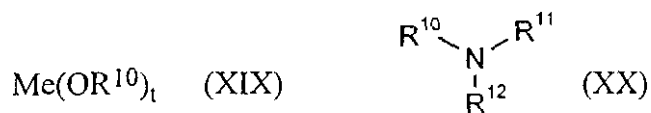
Hal für Halogen steht,

10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
enenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt, oder jeweils

(L) mit Metallverbindungen oder Aminen der Formeln (XIX) oder (XX)

15



in welchen

Me für ein ein- oder zweiwertiges Metall,

20

t für die Zahl 1 oder 2 und

R¹⁰, R¹¹, R¹² unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Alkyl
stehen,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder
jeweils

(Pα) mit Isocyanaten oder Isothiocyanaten der Formel (XXI)

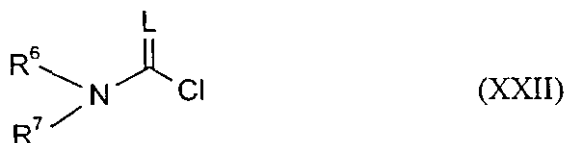


5 in welcher

R^6 und L die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
 10 nenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt, oder jeweils

(β) mit Carbamidsäurechloriden oder Thiocarbamidsäurechloriden der
 Formel (XXII)

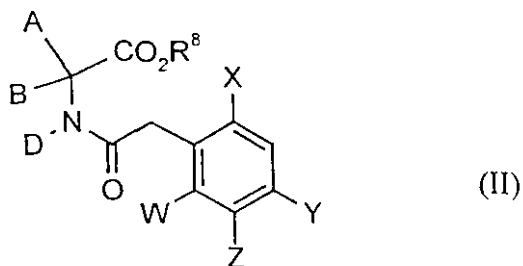


15 in welcher

L, R^6 und R^7 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-
 20 nenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels, umgesetzt.

6. Verbindungen der Formel (II)

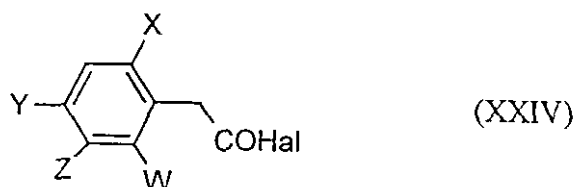


in welcher

A, B, D, W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

5 R⁸ für Alkyl steht.

7. Verbindungen der Formel (XXIV)



in welcher

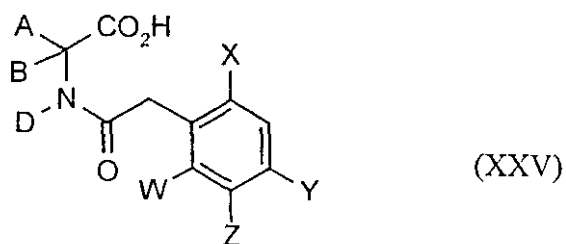
10

W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

Hal für Chlor oder Brom steht.

15

8. Verbindungen der Formel (XXV)

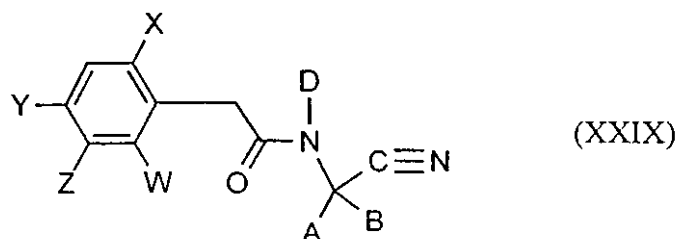


in welcher

20

A, B, D, W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

9. Verbindungen der Formel (XXIX)

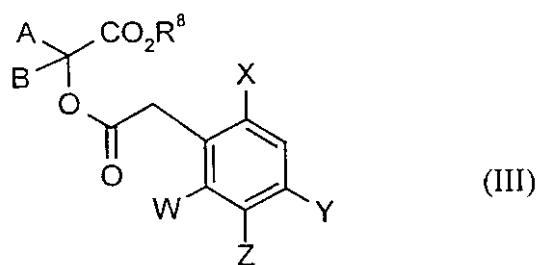


in welcher

A, B, D, W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

5

10. Verbindungen der Formel (III)



10

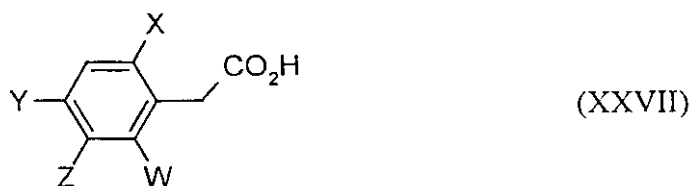
in welcher

A, B, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und

R⁸ für Alkyl steht.

15

11. Verbindungen der Formel (XXVII)

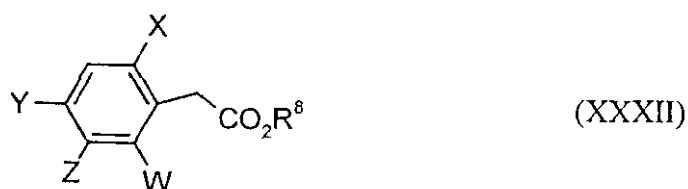


in welcher

20

W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

12. Verbindungen der Formel (XXXII)



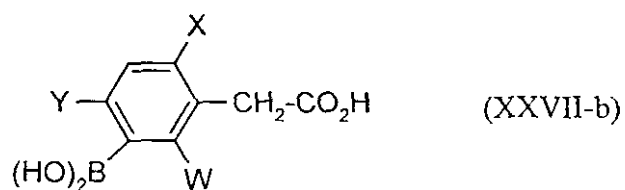
5 in welcher

W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und

R⁸ für Alkyl steht.

10

13. Verbindungen der Formel (XXVII-b)

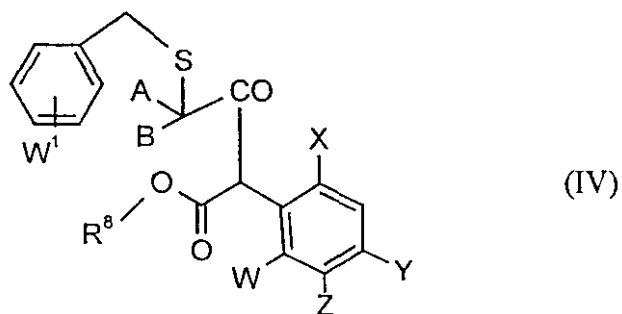


in welcher

15

W, X und Y die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

14. Verbindungen der Formel (IV)

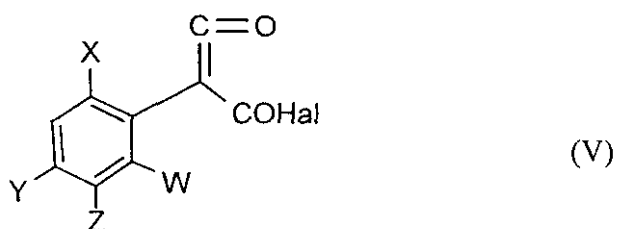


in welcher

A, B, W, W¹, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen
haben und

R⁸ für Alkyl steht.

15. Verbindungen der Formel (V)

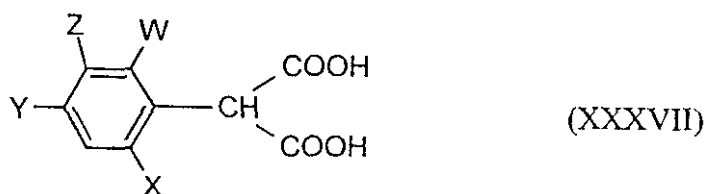


in welcher

W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben
und

Hal für Chlor oder Brom steht.

16. Verbindungen der Formel (XXXVII)

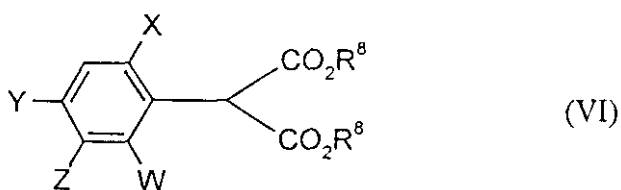


in welcher

W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

5

17. Verbindungen der Formel (VI)



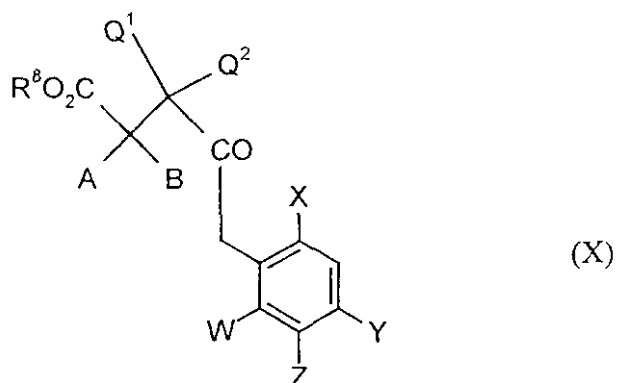
in welcher

10

W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und

R⁸ für Alkyl steht.

15 18. Verbindungen der Formel (X)

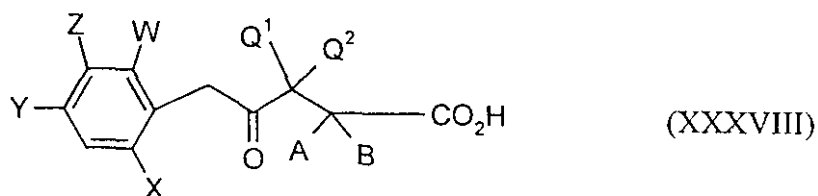


in welcher

A, B, Q¹, Q², W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben
und

5 R⁸ für Alkyl steht.

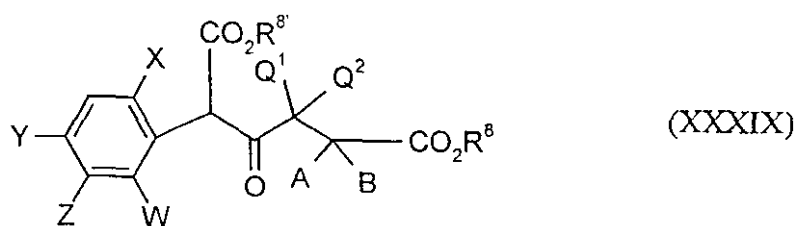
19. Verbindungen der Formel (XXXVIII)



10 in welcher

W, X, Y, Z, A, B, Q¹ und Q² die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

15 20. Verbindungen der Formel (XXXIX)

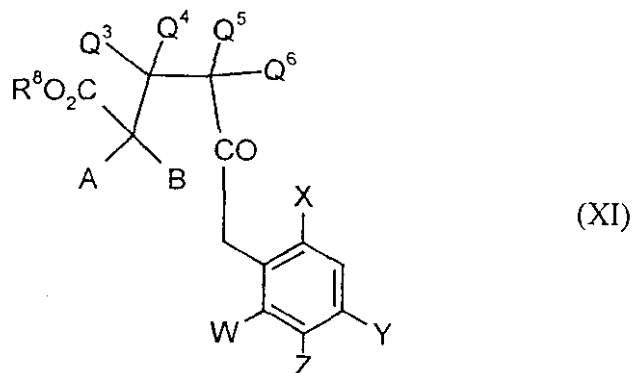


in welcher

20 A, B, D¹, D², W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene
Bedeutung haben und

R⁸ und R^{8'} für Alkyl stehen.

21. Verbindungen der Formel (XI)



in welcher

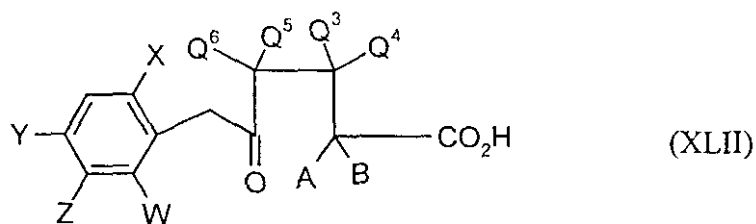
5

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und

R⁸ für Alkyl steht.

10

22. Verbindungen der Formel (XLII)



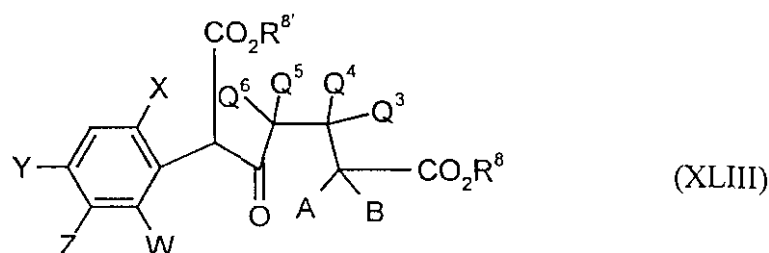
in welcher

15

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

23. Verbindungen der Formel (XLIII)

20



in welcher

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebene
Bedeutung haben und

R⁸ und R^{8'} für Alkyl stehen.

24. Schädlingsbekämpfungsmittel und/oder Unkrautbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1.
25. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen im Pflanzenschutz, Haushaltsbereich, Hygienebereich und Vorratsschutz.
26. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen im Pflanzenschutz, Haushaltsbereich, Hygienebereich und Vorratsschutz, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
27. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln und/oder Unkrautbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 99/01787

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07D209/96 A01N43/08 A01N43/10 A01N43/12 A01N43/36
A01N43/42 C07D207/40 C07D491/10 C07D309/28 C07D307/24
C07D307/94 C07D333/50 C07C49/733 C07C49/88 C07C49/747

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 C07C A01N

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

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 96 25395 A (BAYER AG ; FISCHER REINER (DE); BRETSCHNEIDER THOMAS (DE); HAGEMANN) 22 August 1996 (1996-08-22) abstract; claims page 136, line 5 - line 9 ---	1,6-27
A	WO 97 36868 A (ERDELEN CHRISTOPH ; LIEB VOLKER (DE); SCHNEIDER UDO (DE); WIDDIG AR) 9 October 1997 (1997-10-09) abstract; claims page 144, line 7 - line 12 ---	1,6-27
A	US 5 719 310 A (ERDELEN CHRISTOPH ET AL) 17 February 1998 (1998-02-17) abstract; claims column 127 - column 128; table 7 --- -/--	1,7,10, 24-27

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

4 August 1999

Date of mailing of the international search report

17/08/1999

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

Paisdor, B

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 99/01787

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07C69/24 //(C07D491/10, 313:00, 209:00), (C07D491/10, 311:00, 209:00)

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)

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	DE 196 49 665 A (BAYER AG) 9 October 1997 (1997-10-09) abstract; claims page 62 - page 81 ---	1,6-12, 14,15, 24-27
A	DE 44 31 730 A (BAYER AG) 10 August 1995 (1995-08-10) abstract; claims page 106 - page 109 ---	1,6-9, 11,12, 24-27
A	DE 195 43 864 A (BAYER AG) 14 August 1996 (1996-08-14) abstract; claims page 61 - page 73 ---	1,6-12, 14-17, 24-27
	--- -/-	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

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

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

Date of the actual completion of the international search

4 August 1999

Date of mailing of the international search report

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

Paisdor, B

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 99/01787

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 442 077 A (BAYER AG) 21 August 1991 (1991-08-21) cited in the application abstract; claims page 14 - page 15 ---	1,6-8, 24-27
A	WO 96 20196 A (BAYER AG ; FISCHER REINER (DE); BRETSCHNEIDER THOMAS (DE); BECK GUN) 4 July 1996 (1996-07-04) cited in the application abstract; claims page 57 - page 67 ---	1,7,10, 24-27
A	EP 0 521 334 A (BAYER AG) 7 January 1993 (1993-01-07) cited in the application abstract; claims page 50 - page 51 ---	1,6-8, 24-27
A	WO 97 14667 A (BAYER AG ; FISCHER REINER (DE); RUTHER MICHAEL (DE); GRAFF ALAN (DE) 24 April 1997 (1997-04-24) cited in the application abstract; claims 1,6-12 ---	1,18-20, 24-27
A	US 4 613 617 A (SOUSA ANTHONY A) 23 September 1986 (1986-09-23) cited in the application abstract; claims column 5 - column 6 -----	1,21-27

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No
PCT/EP 99/01787

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9625395 A	22-08-1996	DE 19543864 A AU 4715896 A BR 9606956 A CN 1173866 A EP 0809629 A HU 9800031 A JP 11500114 T ZA 9601107 A	14-08-1996 04-09-1996 28-10-1997 18-02-1996 03-12-1997 28-05-1998 06-01-1999 28-08-1996
WO 9736868 A	09-10-1997	DE 19649665 A AU 2290097 A CN 1215390 A EP 0891330 A	09-10-1997 22-10-1997 28-04-1997 20-01-1999
US 5719310 A	17-02-1998	DE 4337853 A AU 7159994 A BR 9403768 A CN 1103642 A DE 59407726 D EP 0647637 A ES 2127859 T JP 7179450 A US 5610122 A ZA 9407183 A	23-03-1995 30-03-1995 16-05-1995 14-06-1995 11-03-1999 12-04-1995 01-05-1999 18-07-1995 11-03-1997 11-05-1995
DE 19649665 A	09-10-1997	AU 2290097 A CN 1215390 A WO 9736868 A EP 0891330 A	22-10-1997 28-04-1999 09-10-1997 20-01-1999
DE 4431730 A	10-08-1995	AU 1157095 A BR 9500475 A CA 2141923 A CN 1110680 A DE 59501802 D EP 0668267 A ES 2114238 T JP 7252222 A US 5622917 A US 5847211 A ZA 9501006 A	17-08-1995 27-02-1996 10-08-1995 25-10-1995 14-05-1998 23-08-1995 16-05-1998 03-10-1995 22-04-1997 08-12-1998 11-10-1995
DE 19543864 A	14-08-1996	AU 4715896 A BR 9606956 A CN 1173866 A WO 9625395 A EP 0809629 A HU 9800031 A JP 11500114 T ZA 9601107 A	04-09-1996 28-10-1997 18-02-1998 22-08-1996 03-12-1997 28-05-1998 06-01-1999 28-08-1996
EP 0442077 A	21-08-1991	DE 4004496 A DE 59009858 D JP 4211056 A	22-08-1991 14-12-1995 03-08-1992
WO 9620196 A	04-07-1996	DE 19540736 A AU 4342096 A BR 9510256 A	27-06-1996 19-07-1996 04-11-1997

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/01787

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9620196 A		CA 2208375 A	04-07-1996
		CN 1175257 A	04-03-1996
		EP 0799228 A	08-10-1997
		HU 77880 A	28-09-1998
		JP 10511366 T	04-11-1998
		PL 322741 A	16-02-1998
		US 5830825 A	03-11-1998
		ZA 9510888 A	24-06-1996
EP 0521334 A	07-01-1993	DE 4121365 A	14-01-1993
		CA 2072280 A	29-12-1992
		DE 59209490 D	15-10-1998
		ES 2120424 T	01-11-1998
		JP 5221971 A	31-08-1993
		MX 9203644 A	01-11-1993
		US 5589469 A	31-12-1996
		US 5616536 A	01-04-1997
WO 9714667 A	24-04-1997	DE 19538218 A	17-04-1997
		AU 707451 B	08-07-1999
		AU 7283796 A	07-05-1997
		EP 0854852 A	29-07-1998
		PL 326224 A	31-08-1998
US 4613617 A	23-09-1986	NONE	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

In itionales Aktenzeichen

PCT/EP 99/01787

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07D209/96 A01N43/08 A01N43/10 A01N43/12 A01N43/36
A01N43/42 C07D207/40 C07D491/10 C07D309/28 C07D307/24
C07D307/94 C07D333/50 C07C49/733 C07C49/88 C07C49/747

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D C07C A01N

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

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

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie ³	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 96 25395 A (BAYER AG ; FISCHER REINER (DE); BRETSCHNEIDER THOMAS (DE); HAGEMANN) 22. August 1996 (1996-08-22) Zusammenfassung; Ansprüche Seite 136, Zeile 5 - Zeile 9 ---	1,6-27
A	WO 97 36868 A (ERDELEN CHRISTOPH ; LIEB VOLKER (DE); SCHNEIDER UDO (DE); WIDDIG AR) 9. Oktober 1997 (1997-10-09) Zusammenfassung; Ansprüche Seite 144, Zeile 7 - Zeile 12 ---	1,6-27
A	US 5 719 310 A (ERDELEN CHRISTOPH ET AL) 17. Februar 1998 (1998-02-17) Zusammenfassung; Ansprüche Spalte 127 - Spalte 128; Tabelle 7 ---	1,7,10, 24-27
	--- -/--	



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

³ 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 erfindenscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

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

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

4. August 1999

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

17/08/1999

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

Paisdor, B

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07C69/24 //(C07D491/10,313:00,209:00),(C07D491/10,311:00,209:00)

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

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)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie ¹	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	DE 196 49 665 A (BAYER AG) 9. Oktober 1997 (1997-10-09) Zusammenfassung; Ansprüche Seite 62 - Seite 81 ---	1,6-12, 14,15, 24-27
A	DE 44 31 730 A (BAYER AG) 10. August 1995 (1995-08-10) Zusammenfassung; Ansprüche Seite 106 - Seite 109 ---	1,6-9, 11,12, 24-27
A	DE 195 43 864 A (BAYER AG) 14. August 1996 (1996-08-14) Zusammenfassung; Ansprüche Seite 61 - Seite 73 ---	1,6-12, 14-17, 24-27

	---/---	



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

¹ 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 erfindenscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindenscher 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 nahelegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

4. August 1999

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

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

Paisdor, B

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 442 077 A (BAYER AG) 21. August 1991 (1991-08-21) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche Seite 14 - Seite 15 ---	1,6-8, 24-27
A	WO 96 20196 A (BAYER AG ; FISCHER REINER (DE); BRETSCHNEIDER THOMAS (DE); BECK GUN) 4. Juli 1996 (1996-07-04) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche Seite 57 - Seite 67 ---	1,7,10, 24-27
A	EP 0 521 334 A (BAYER AG) 7. Januar 1993 (1993-01-07) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche Seite 50 - Seite 51 ---	1,6-8, 24-27
A	WO 97 14667 A (BAYER AG ; FISCHER REINER (DE); RUTHER MICHAEL (DE); GRAFF ALAN (DE) 24. April 1997 (1997-04-24) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche 1,6-12 ---	1,18-20, 24-27
A	US 4 613 617 A (SOUSA ANTHONY A) 23. September 1986 (1986-09-23) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche Spalte 5 - Spalte 6 -----	1,21-27

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/01787

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9625395 A	22-08-1996	DE 19543864 A	14-08-1996
		AU 4715896 A	04-09-1996
		BR 9606956 A	28-10-1997
		CN 1173866 A	18-02-1996
		EP 0809629 A	03-12-1997
		HU 9800031 A	28-05-1998
		JP 11500114 T	06-01-1999
		ZA 9601107 A	28-08-1996
WO 9736868 A	09-10-1997	DE 19649665 A	09-10-1997
		AU 2290097 A	22-10-1997
		CN 1215390 A	28-04-1997
		EP 0891330 A	20-01-1999
US 5719310 A	17-02-1998	DE 4337853 A	23-03-1995
		AU 7159994 A	30-03-1995
		BR 9403768 A	16-05-1995
		CN 1103642 A	14-06-1995
		DE 59407726 D	11-03-1999
		EP 0647637 A	12-04-1995
		ES 2127859 T	01-05-1999
		JP 7179450 A	18-07-1995
		US 5610122 A	11-03-1997
		ZA 9407183 A	11-05-1995
DE 19649665 A	09-10-1997	AU 2290097 A	22-10-1997
		CN 1215390 A	28-04-1999
		WO 9736868 A	09-10-1997
		EP 0891330 A	20-01-1999
DE 4431730 A	10-08-1995	AU 1157095 A	17-08-1995
		BR 9500475 A	27-02-1996
		CA 2141923 A	10-08-1995
		CN 1110680 A	25-10-1995
		DE 59501802 D	14-05-1998
		EP 0668267 A	23-08-1995
		ES 2114238 T	16-05-1998
		JP 7252222 A	03-10-1995
		US 5622917 A	22-04-1997
		US 5847211 A	08-12-1998
		ZA 9501006 A	11-10-1995
DE 19543864 A	14-08-1996	AU 4715896 A	04-09-1996
		BR 9606956 A	28-10-1997
		CN 1173866 A	18-02-1998
		WO 9625395 A	22-08-1996
		EP 0809629 A	03-12-1997
		HU 9800031 A	28-05-1998
		JP 11500114 T	06-01-1999
		ZA 9601107 A	28-08-1996
EP 0442077 A	21-08-1991	DE 4004496 A	22-08-1991
		DE 59009858 D	14-12-1995
		JP 4211056 A	03-08-1992
WO 9620196 A	04-07-1996	DE 19540736 A	27-06-1996
		AU 4342096 A	19-07-1996
		BR 9510256 A	04-11-1997

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/01787

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9620196 A		CA 2208375 A	04-07-1996
		CN 1175257 A	04-03-1996
		EP 0799228 A	08-10-1997
		HU 77880 A	28-09-1998
		JP 10511366 T	04-11-1998
		PL 322741 A	16-02-1998
		US 5830825 A	03-11-1998
		ZA 9510888 A	24-06-1996
EP 0521334 A	07-01-1993	DE 4121365 A	14-01-1993
		CA 2072280 A	29-12-1992
		DE 59209490 D	15-10-1998
		ES 2120424 T	01-11-1998
		JP 5221971 A	31-08-1993
		MX 9203644 A	01-11-1993
		US 5589469 A	31-12-1996
		US 5616536 A	01-04-1997
WO 9714667 A	24-04-1997	DE 19538218 A	17-04-1997
		AU 707451 B	08-07-1999
		AU 7283796 A	07-05-1997
		EP 0854852 A	29-07-1998
		PL 326224 A	31-08-1998
US 4613617 A	23-09-1986	KEINE	

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07D209/96

[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 99806593.5

A01N 43/08 A01N 43/10

A01N 43/12 A01N 43/36

A01N 43/42 C07D207/40

C07D491/10 C07D309/28

C07D307/24 C07D307/94

C07D333/50 C07C 49/733

[43] 公开日 2001 年 7 月 11 日

[11] 公开号 CN 1303375A

[22] 申请日 1999.3.18 [21] 申请号 99806593.5

[30] 优先权

[32] 1998.3.26 [33] DE [31] 19813354.5

[86] 国际申请 PCT/EP99/01787 1999.3.18

[87] 国际公布 WO99/48869 德 1999.9.30

[85] 进入国家阶段日期 2000.11.24

[71] 申请人 拜尔公司

地址 德国莱沃库森

[72] 发明人 F·利布 R·菲舍尔 A·格拉夫

U·施奈德尔 T·布雷特施奈德

C·埃尔德伦 W·安德施

M·W·德鲁斯 M·多林格

I·维特肖洛夫斯基 R·A·迈尔斯

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

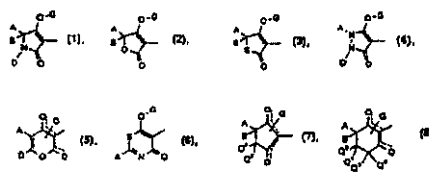
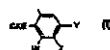
代理人 王景朝 郎红

权利要求书 38 页 说明书 158 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 芳基苯基取代的环状酮烯醇类化合物

[57] 摘要

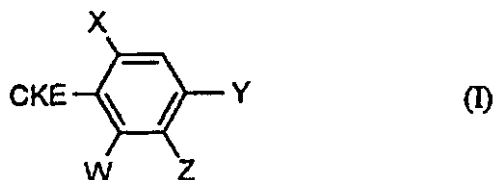
本发明涉及一种新的式(I)的芳基苯基取代的酮烯醇类,其中 X 表示卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基、氰基或均任选地被取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基烷氧基或苯基烷硫基;Z 是可能被取代的环烷基、芳基或杂芳基;W 和 Z 相互独立地各表示氢、卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基或氰基,CKE 表示下列基团(1)、(2)、(3)、(4)、(5)、(6)、(7)或(8)之一,其中 A、B、D、G 和 Q¹至 Q⁶具有说明书中给出的含义。本发明还涉及几种生产所述的酮烯醇类的方法及其作为有害生物防治剂和除草剂的应用。



ISSN 1008-4274

权 利 要 求 书

1. 式(I)化合物



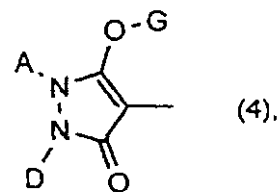
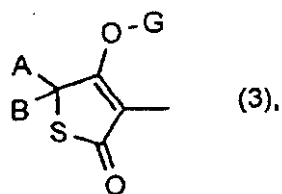
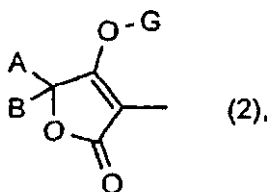
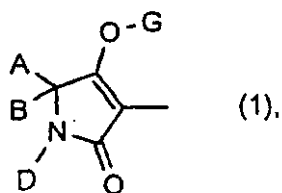
5 其中

X 表示卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基、氰基或均任选地被取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基烷氧基或苯基烷硫基,

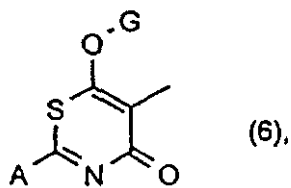
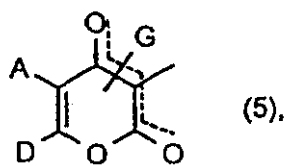
10 Z 表示均任选地被取代的环烷基、芳基或杂芳基,

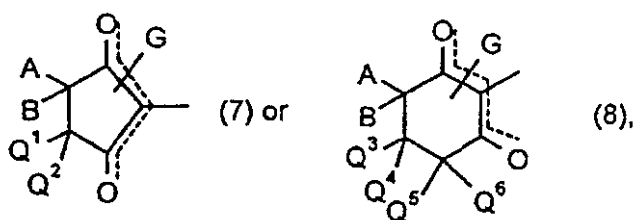
W 和 Y 相互独立地各表示氢、卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基或氰基,

CKE 表示下列基团之一:



15





其中

A 表示氢，均任选由卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、
5 多烷氧基烷基、烷硫基烷基、饱和或不饱和的任选至少一个环原子由
杂原子替代的任选被取代的环烷基，或均任选由卤素-、烷基-、卤代
烷基-、烷氧基-、卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的芳基、芳烷基
或杂芳基，

B 表示氢、烷基或烷氧基烷基，或

10 A 和 B 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的未取代或
取代的环，该环任选地含有至少一个杂原子，

D 表示氢或一个任选被取代的选自下列的基团：烷基、链烯
基、炔基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷硫基烷基，饱和或不饱和
的有一或多个环成员任选地由杂原子替代的环烷基，芳烷基、芳基、
15 杂芳基烷基或杂芳基或

A 和 D 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的环，该环
在 A、D 部分是未取代或取代的且它任选地含有至少一个(在其中 CKE
= (4)的情况下另外的)杂原子，或

A 和 Q¹ 一起表示烷二基或链烯二基，它们各任选由在每种情况下
20 均为任选被取代的烷基、羟基、烷氧基、烷硫基、环烷基、苄氧基或
芳基取代，或

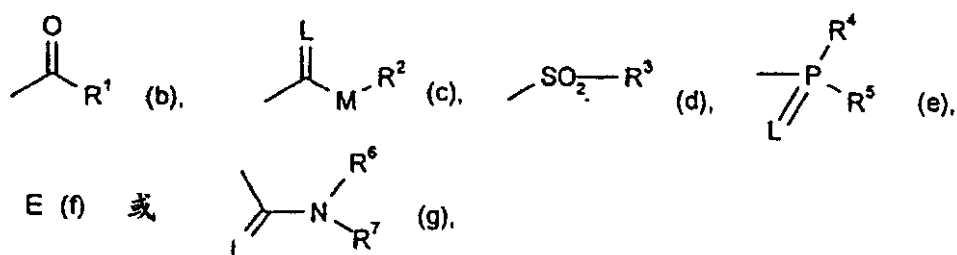
Q¹ 表示氢或烷基，

Q²、Q⁴、Q⁵ 和 Q⁶ 相互独立地各表示氢或烷基，

Q³ 表示氢、烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、任选被取代的环
25 烷基(其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代)或任选被取代的苯基，或

Q³ 和 Q⁴ 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的未取代或
取代的任选地含有杂原子的环，

G 表示氢(a)或表示下列基团之一：



其中

E 表示金属离子或铵离子,

5 L 表示氧或硫,

M 表示氧或硫,

R¹ 表示均任选由卤素-取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或任选由卤素-、烷基-或烷氧基-取代的可以
 10 间入至少一个杂原子的环烷基, 均任选地被取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苯氧基烷基或杂芳氧基烷基,

R² 表示均任选由卤素-取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基或表示均任选地被取代的环烷基、苯基或苄基,

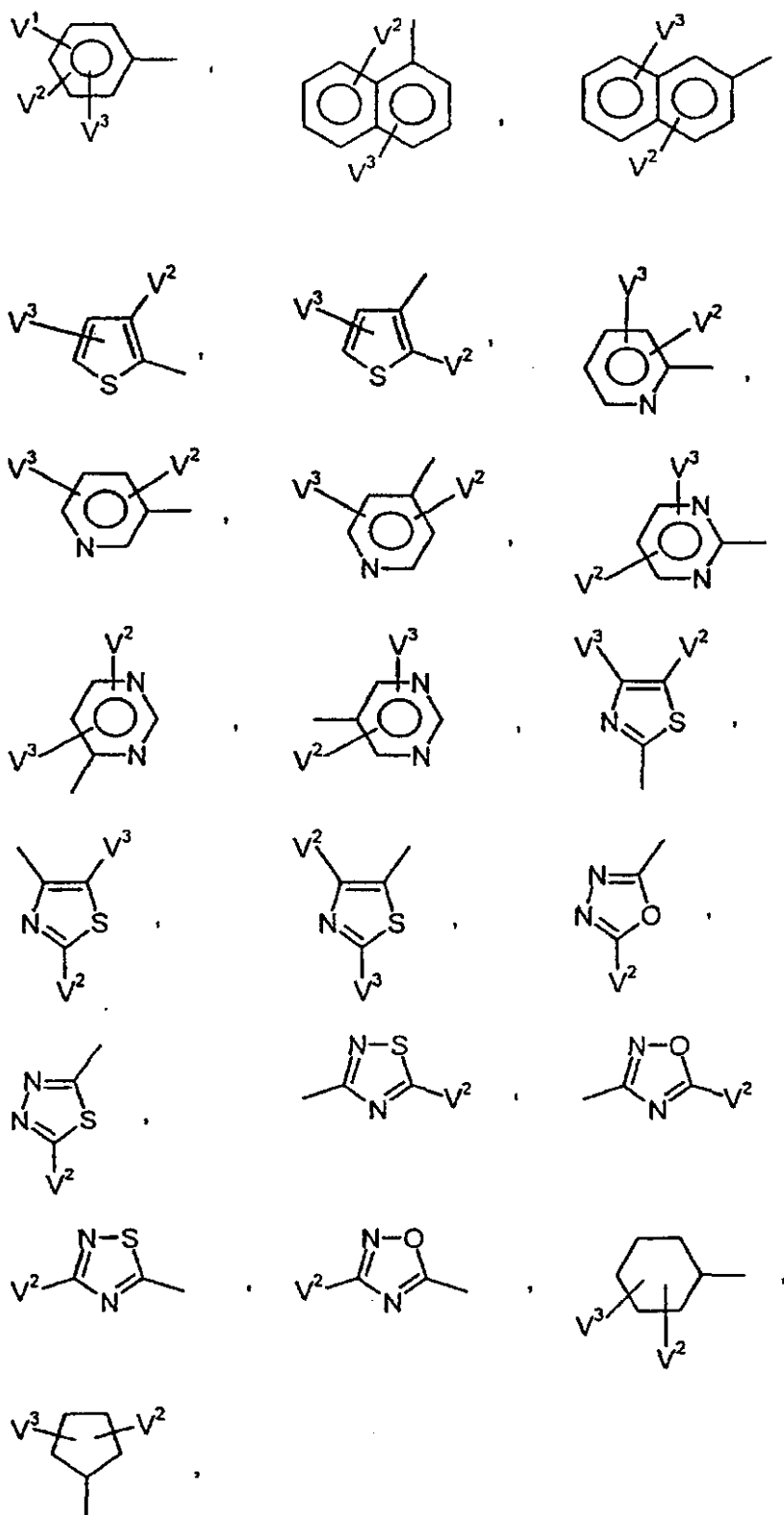
R³、R⁴和R⁵相互独立地各表示均任选由卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、链烯硫基、环烷基硫基或表示均任
 15 选地被取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基, 和

R⁶和R⁷相互独立地各表示氢, 均任选由卤素取代的烷基、环烷基、链烯基、烷氧基、烷氧基烷基, 表示任选被取代的苯基, 表示任选被取代的苄基, 或与其连接的氮原子一起表示一个任选间入氧或硫的
 20 环。

2. 权利要求1的式(I)化合物, 其中

X 表示卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₆-链烯氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₆-卤代链烯氧基、硝基、氰基或均任选由卤素
 25 -、C₁-C₆-烷基-、C₁-C₆-烷氧基-、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苄氧基或苄硫基,

Z 表示下列基团之一:



V^1 表示氢、卤素、 C_1-C_{12} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、
5 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤

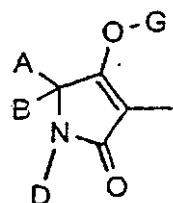
代烷氧基、硝基、氰基，或表示苯基、苯氧基、苯氧基- C_1-C_4 -烷基、苯基- C_1-C_4 -烷氧基、苯硫基- C_1-C_4 -烷基或苯基- C_1-C_4 -烷硫基，这些基团均任选由卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基或氰基单或多取代，

- 5 V^2 和 V^3 相互独立地各表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基，

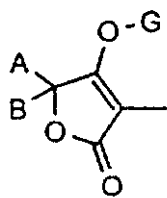
W 和 Y 相互独立地各表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、硝基或氰基，

CKE 表示下列基团之一

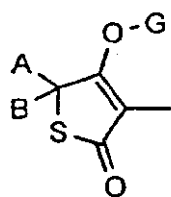
10



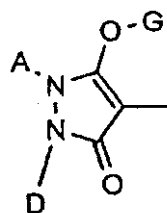
(1),



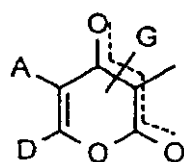
(2),



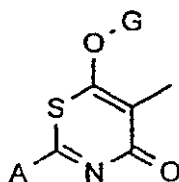
(3),



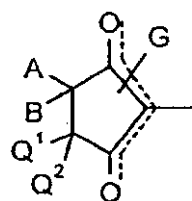
(4),



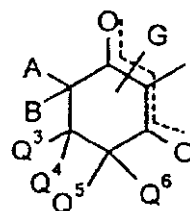
(5),



(6),



(7),



(8),

A 表示氢或均任选由卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其

- 15 中任选地一或二个不直接相邻的环成员由氧和 / 或硫替代的 C_3-C_8 -环

烷基，或表示均任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的 C_6 -或 C_{10} -芳基、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基或 C_6 -或 C_{10} -芳基- C_1-C_6 -烷基，

B 表示氢、 C_1-C_{12} -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基，或

- 5 A、B 和其连接的碳原子表示饱和 C_3-C_{10} -环烷基或不饱和 C_5-C_{10} -环烷基，其中任选地一个环成员由氧或硫替代，且它们任选由 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_{10} -环烷基、 C_1-C_8 -卤代烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷硫基、卤素或苯基单或二取代，或

- 10 A、B 和其连接的碳原子表示 C_3-C_6 -环烷基，该环烷基由一个任选地含有一或二个不直接相邻的氧和 / 或硫原子的亚烷基二基取代，或由亚烷二氧基或由亚烷二硫基取代，其与其所连接的碳原子一起形成另一个五-至八元环，或

- 15 A、B 和其连接的碳原子表示 C_3-C_8 -环烷基或 C_5-C_8 -环烯基，其中二个取代基与它们连接的碳原子一起表示均任选由 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-或卤素-取代的 C_2-C_6 -烷二基、 C_2-C_6 -链烯二基或 C_4-C_6 -烷二烯二基，其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代，

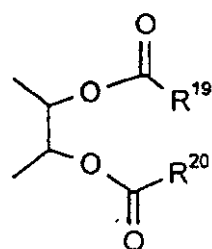
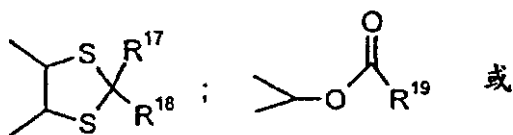
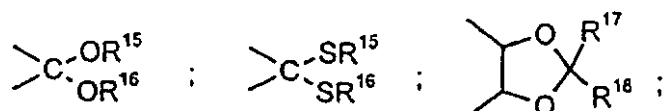
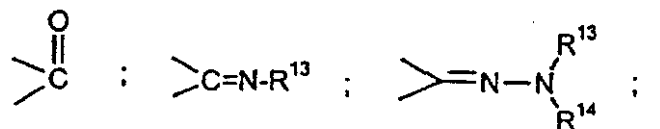
- 20 D 表示氢，均任选由卤素-取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_3-C_8 -炔基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷硫基- C_2-C_8 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷基-取代的其中任选地一个环成员由氧和 / 或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基，或表示均任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基、苯基- C_1-C_6 -烷基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳基- C_1-C_6 -烷基，

- 25 A 和 D 一起表示均任选地被取代的 C_3-C_6 -烷二基或 C_3-C_6 -链烯二基，其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代，并且其中

可能的取代基各为：

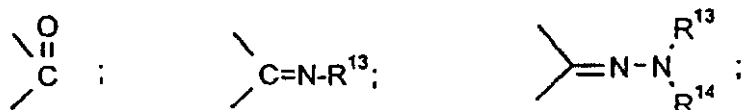
- 30 卤素、羟基、巯基或均任选由卤素-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_3-C_7 -环烷基、苯基或苄氧基，或另一 C_3-C_6 -烷二基、 C_3-C_6 -链烯二基或一个丁二烯基，它们任选由 C_1-C_6 -烷基取代或其中任选地二个相邻的取代基与其连接的碳原子一起形成另一具有 5 或 6 个环原子的饱和或不饱和环(在式(I-1)化合物的情况

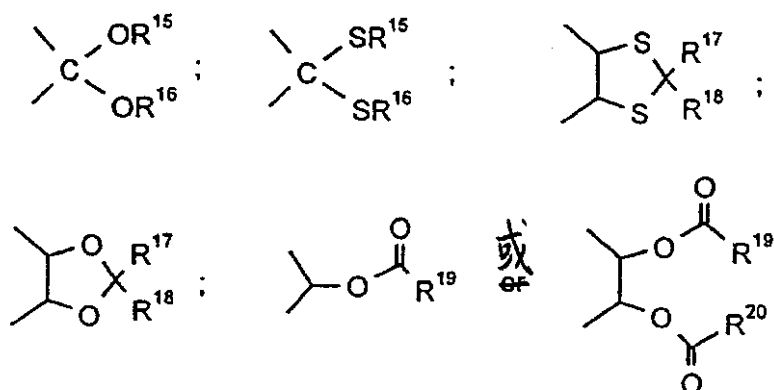
下, A 和 D, 与其连接的碳原子一起, 表示, 例如下文提到的基团 AD-1 至 AD-10), 该环可以含有氧或硫, 或其中任选地含有下列基团之一:



5 或

- A 和 Q¹ 一起表示 C₃-C₆-烷二基或 C₄-C₆-链烯二基, 它们各任选由相同或不同的选自下列的基团单或二取代: 卤素、羟基, 各任选由相同或不同的卤素单至三取代的 C₁-C₁₀-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₃-C₇-环烷基, 和各任选由相同或不同的选自卤素、C₁-C₆-烷基或 C₁-C₆-烷氧基的基团单至三取代的苄氧基或苄基, 且所述 C₃-C₆-烷二基或 C₄-C₆-链烯二基还任选地含有下列基团之一:





或由一个 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷二基或由氧原子桥接, 或

Q^1 表示氢或 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基,

5 Q^2 、 Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地各表示氢或 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基,

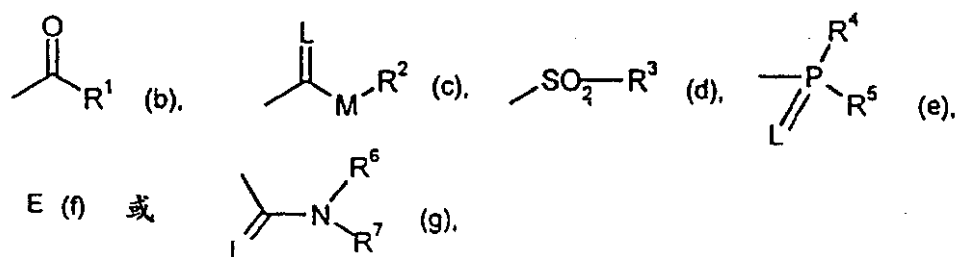
Q^3 表示氢、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷硫基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、任选由 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-或 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基或任选由卤素-、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基-、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷氧基-、氰基-或硝基-取代的苯基, 或

10

Q^3 和 Q^4 与其连接的碳原子一起表示一个任选由 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基-或 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 $\text{C}_3\text{-C}_7$ -环,

G 表示氢(a)或表示下列基团之一:

15



其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫,

- 5 R^1 表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_{20} -烷基、 C_2-C_{20} -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_8 -烷硫基- C_1-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基或任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其中任选地一或多个不直接相邻的环成员由氧和 / 或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基,

表示任选由卤素-、氟基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、 C_1-C_6 -烷硫基-或 C_1-C_6 -烷基磺酰基-取代的苯基,

- 10 表示任选由卤素-、氟基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷基-或 C_1-C_6 -卤代烷氧基-取代的苯基- C_1-C_6 -烷基,

表示任选由卤素-或 C_1-C_6 -烷基-取代的 5 或 6 员的杂芳基,

表示任选由卤素-或 C_1-C_6 -烷基-取代的苯氧基- C_1-C_6 -烷基, 或

- 15 表示任选由卤素-、氨基-或 C_1-C_6 -烷基取代的 5-或 6-元杂芳氧基- C_1-C_6 -烷基,

R^2 表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_{20} -烷基、 C_2-C_{20} -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基,

表示任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的 C_3-C_8 -环烷基, 或

- 20 表示均可任选由卤素-、氟基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-或 C_1-C_6 -卤代烷氧基-取代的苯基或苄基,

R^3 表示任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基, 或表示均可任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、氨基-或硝基-取代的苯基或苄基,

- 25 R^4 和 R^5 相互独立地各表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷基氨基、二-(C_1-C_8 -烷基)氨基、 C_1-C_8 -烷硫基、 C_2-C_8 -链烯硫基、 C_3-C_7 -环烷基硫基, 或表示均可任选由卤素-、氟基-、硝基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、 C_1-C_4 -烷硫基-、 C_1-C_4 -卤代烷硫基-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -卤代烷基-取代的苯基、苯氧基或
- 30 苯硫基,

R^6 和 R^7 相互独立地各表示氢, 表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -

烷基，表示任选由卤素-、 C_1-C_8 -卤代烷基-、 C_1-C_8 -烷基-或 C_1-C_8 -烷氧基-取代的苯基，任选由卤素-、 C_1-C_8 -烷基-、 C_1-C_8 -卤代烷基-或 C_1-C_8 -烷氧基-取代的苄基或一起表示一个任选由 C_1-C_4 -烷基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_6 -亚烷基，

- 5 R^{13} 表示氢，表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基，表示任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基，或表示均可任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯基- C_1-C_4 -烷基或苯基- C_1-C_4 -烷氧基，

R^{14} 表示氢或 C_1-C_8 -烷基，或

R^{13} 和 R^{14} 一起表示 C_4-C_6 -烷二基，

R^{15} 和 R^{16} 相同或不同且表示 C_1-C_6 -烷基，或

- 15 R^{15} 和 R^{16} 一起表示一个 C_2-C_4 -烷二基，它任选由 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基或由任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基取代，

R^{17} 和 R^{18} 相互独立地表示氢，表示任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基，或表示任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基，或

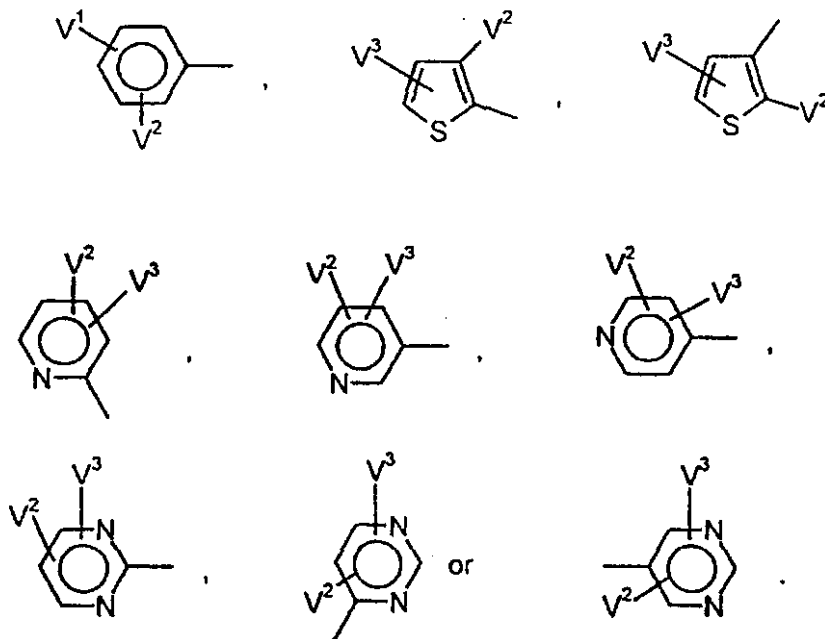
- 20 R^{17} 和 R^{18} 与其连接的碳原子一起表示一个羰基，或表示任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_5-C_7 -环烷基，

- 25 R^{19} 和 R^{20} 相互独立地各表示 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -链烯基、 C_1-C_{10} -烷氧基、 C_1-C_{10} -烷基氨基、 C_3-C_{10} -链烯氨基、二- $(C_1-C_{10}$ -烷基)氨基或二- $(C_3-C_{10}$ -链烯基)氨基。

3. 权利要求 1 的式(I)化合物，其中

X 表示氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_4 -链烯氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_4 -卤代链烯氧基、硝基或氰基，

- 30 Z 表示下列基团之一：

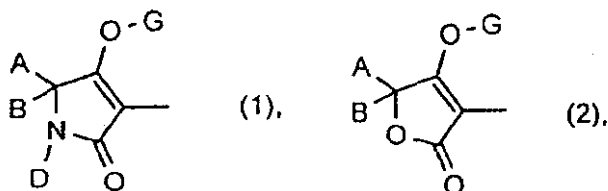


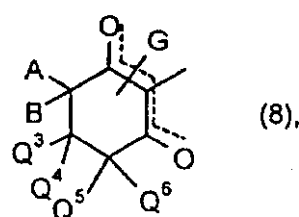
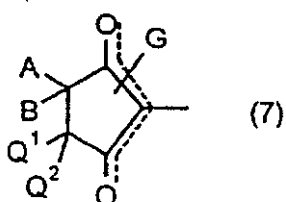
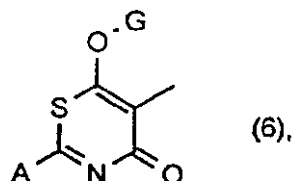
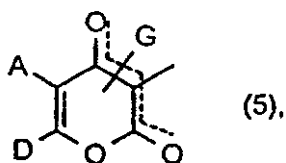
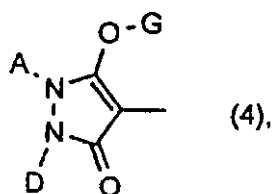
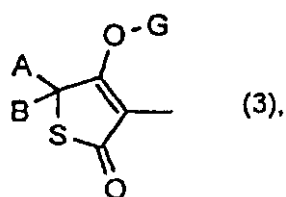
5 V^1 表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基、氰基，或表示苯基、苯氧基、苯氧基- C_1-C_2 -烷基、苯基- C_1-C_2 -烷氧基、苯硫基- C_1-C_2 -烷基或苯基- C_1-C_2 -烷硫基，这些基团各任选由氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基或氰基单或二取代，

10 V^2 和 V^3 相互独立地各表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基或 C_1-C_2 -卤代烷氧基，

W 和 Y 相互独立地各表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基，

CKE 表示下列基团之一：





A 表示氢，或表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基或(但不在式(I-5)、(I-7)和(I-8)的情况下)均可任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷氧基-取代的苯基、呋喃基、吡啶基、咪唑基、三唑基、吡唑基、噻啶基、噻唑基、噻吩基或苯基- C_1-C_4 -烷基，

10 B 表示氢或 C_1-C_6 -烷基，或

A、B 和其连接的碳原子表示饱和或不饱和的 C_5-C_7 -环烷基，其中任选地一个环成员由氧或硫替代且其任选由 C_1-C_5 -烷基、 C_5-C_8 -环烷基、 C_1-C_3 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、氟、氯或苯基单取代，或

15 A、B 和其连接的碳原子表示 C_5-C_6 -环烷基，它由一个任选地含有一或二个不直接相邻的氧或硫原子的亚烷基二基或由亚烷二氧基或由亚烷二硫基取代，这些基团与其连接的碳原子一起形成另一个五或六个环，或

20 A、B 和其连接的碳原子表示 C_3-C_6 -环烷基或 C_5-C_6 -环烯基，其中二个取代基与其连接的碳原子一起表示均可任选由 C_1-C_5 -烷基-、 C_1-C_5 -烷氧基-、氟-、氯-或溴-取代的 C_2-C_4 -烷二基或 C_2-C_4 -链烯二基，

其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代, 或表示丁二烯二基,

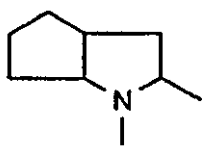
D 表示氢, 或表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_3-C_6 -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基或 C_1-C_8 -烷硫基- C_2-C_6 -烷基, 表示任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_2 -卤代烷基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基或(但在式(I-1)和(I-4)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷氧基-取代的苯基、呋喃基、咪唑基、吡啶基、噻唑基、吡唑基、嘧啶基、吡咯基、噻吩基、三唑基或苯基- C_1-C_4 -烷基, 或

10 A 和 D 一起表示任选被取代的 C_3-C_6 -烷二基, 其中一个亚甲基可以由一个羰基、氧或硫替代, 可能的取代基为羟基、 C_1-C_6 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基, 或

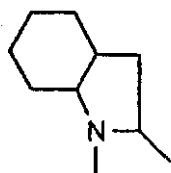
A 和 D(在式(I-1)的情况下)与其连接的原子一起表示基团 AD-1 至 AD-10 之一:

15

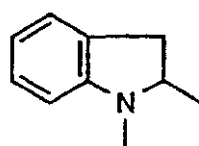
AD-10:



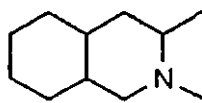
AD-1



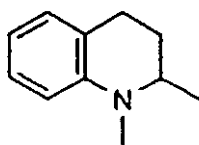
AD-2



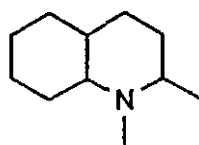
AD-3



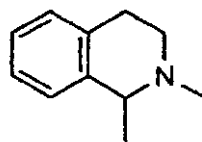
AD-4



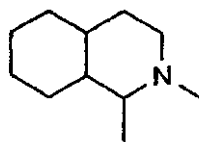
AD-5



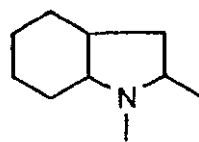
AD-6



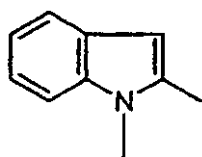
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

- A 和 Q^1 一起表示 C_3-C_4 -烷二基或 C_3-C_4 -链烯二基, 它们各任选由相同或不同的选自下列的基团单或二取代: 氟、氯、羟基和各任选由
- 5 氟单至三取代的 C_1-C_8 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基, 或

Q^1 表示氢,

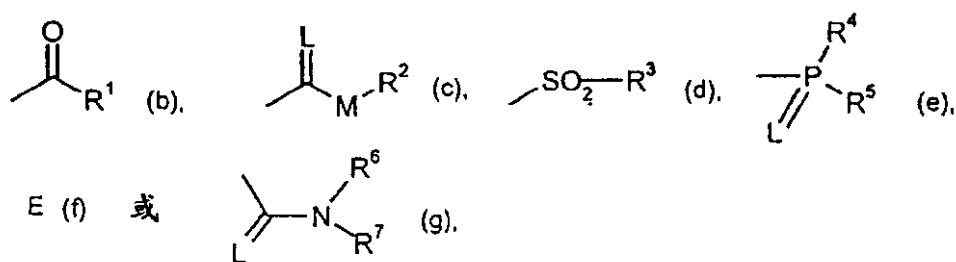
Q^2 表示氢,

Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地各表示氢或 C_1-C_3 -烷基,

- Q^3 表示氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫
- 10 基- C_1-C_2 -烷基或任选由甲基-或甲氧基-取代的、其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基, 或

Q^3 和 Q^4 与其连接的碳原子一起表示一个任选由 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的饱和的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_5-C_6 -环,

- 15 G 表示氢(a)或表示下列基团之一:



其中

E 表示金属离子或铵离子,

20 L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫,

R^1 表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -链烯

基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、多- C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基或任选由氟-、氯-、 C_1-C_5 -烷基或 C_1-C_5 -烷氧基-取代的其中任选地一或二个不直接相连的环成员由氧和 / 或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基,

- 5 表示任选由氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-、 C_1-C_3 -卤代烷氧基-、 C_1-C_4 -烷硫基-或 C_1-C_4 -烷基磺酰基-取代的苯基,

表示任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-或 C_1-C_3 -卤代烷氧基-取代的苯基- C_1-C_4 -烷基,

- 10 表示均可任选由氟-、氯-、溴-或 C_1-C_4 -烷基-取代的吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基,

表示任选由氟-、氯-、溴-或 C_1-C_4 -取代的苯氧基- C_1-C_3 -烷基, 或

- 15 表示均可任选由氟-、氯-、溴-、氨基-或 C_1-C_4 -烷基-取代的吡啶氧基- C_1-C_3 -烷基、嘧啶氧基- C_1-C_3 -烷基或噻唑氧基- C_1-C_3 -烷基,

R^2 表示均可任选由氟-取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基或多- C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基,

表示任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的 C_3-C_7 -环烷基, 或

- 20 表示均可任选由氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_3 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-或 C_1-C_3 -卤代烷氧基-取代的苯基或苄基,

- 25 R^3 表示任选由氟-取代的 C_1-C_6 -烷基, 或表示均可任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-、 C_1-C_3 -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基,

- 30 R^4 和 R^5 相互独立地各表示 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷基氨基、二- $(C_1-C_6$ -烷基)氨基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_3-C_4 -链烯硫基、 C_3-C_6 -环烷基硫基, 或表示均可任选由氟-、氯-、溴-、硝基-、氟基-、 C_1-C_3 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷氧基-、 C_1-C_3 -烷硫基-、 C_1-C_3 -卤代烷硫基-、 C_1-C_3 -烷基-或 C_1-C_3 -卤代烷基-取代的苯基、苯氧基或苯硫基,

R^6 和 R^7 相互独立地各表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基, 表示任选由氟-、

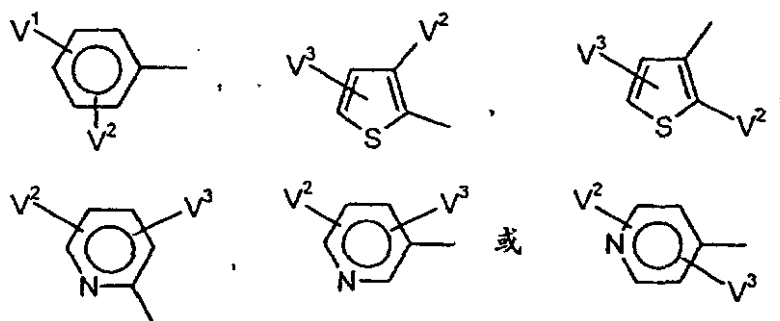
氯-、溴-、 C_1-C_3 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的苯基，表示任选由氯-、氟-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的苄基，或一起表示一个任选由甲基-或乙基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_4-C_5 -亚烷基。

5 4. 权利要求 1 的式 (I) 化合物，其中

X 表示氟、氯、甲基、乙基、丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、硝基或氰基，

Z 表示下列基团之一：

10



V^1 表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、硝基、氰基或任选由氟、氯、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基，

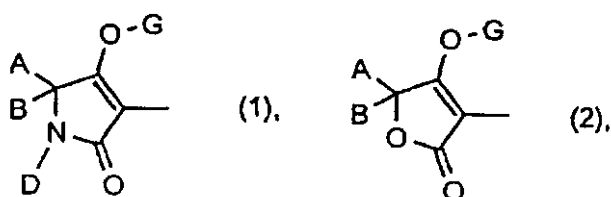
15

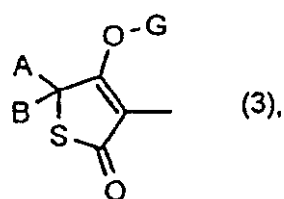
V^2 和 V^3 相互独立地各表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基，

W 和 Y 相互独立地各表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、甲氧基、乙氧基或丙氧基，

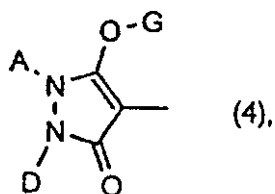
20

CKE 表示下列基团之一：

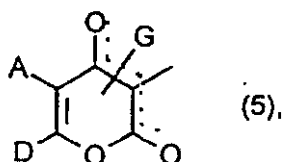




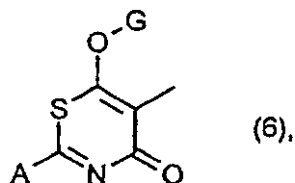
(3),



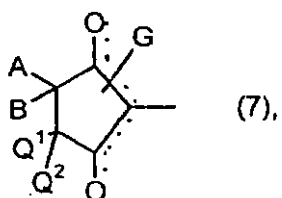
(4),



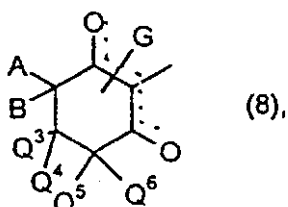
(5),



(6),



(7),



(8),

- A 表示氢, 或表示各任选由氟-取代的 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、任选由氟-、甲基-、乙基-或甲氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基或(但不在式(I-5)、(I-7)和(I-8)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基,

B 表示氢或 C_1-C_4 -烷基, 或

- 10 A、B 与其连接的碳原子一起表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中任选地一个环成员由氧或硫替代且它任选由甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、氟或氯取代, 或

- 15 A、B 与其连接的碳原子一起表示 C_5-C_6 -环烷基或 C_5-C_6 -环烯基, 其中二个取代基与其连接的碳原子一起表示其中各任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_2-C_4 -烷二基或 C_2-C_4 -链烯二基, 或表示丁二烯二基,

D 表示氢, 表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_4 -

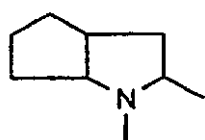
- 链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_2-C_4 -烷基或其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基或(但不在式(I-1)和(I-4)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基或苄基，

或

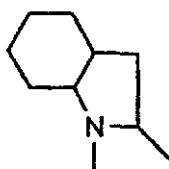
A 和 D 一起表示任选被取代的 C_3-C_4 -烷二基，其中任选地一个碳原子由硫替代且它任选由羟基、甲基、乙基、甲氧基或乙氧基取代，

或

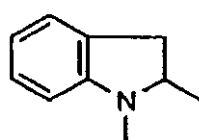
- 10 A 和 D(在式(I-1)化合物的情况下)与其连接的原子一起表示下列基团 AD 之一:



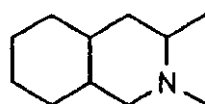
AD-1



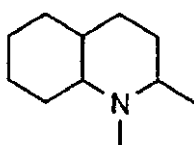
AD-2



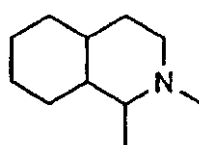
AD-3



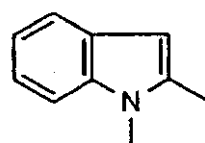
AD-4



AD-6



AD-8



AD-10

- A 和 Q^1 一起表示任选由氟、羟基、甲基或甲氧基单-或二取代的 C_3-C_4 -烷二基或丁烯二基，或

Q^1 表示氢，

Q^2 表示氢，

Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地表示氢、甲基或乙基，

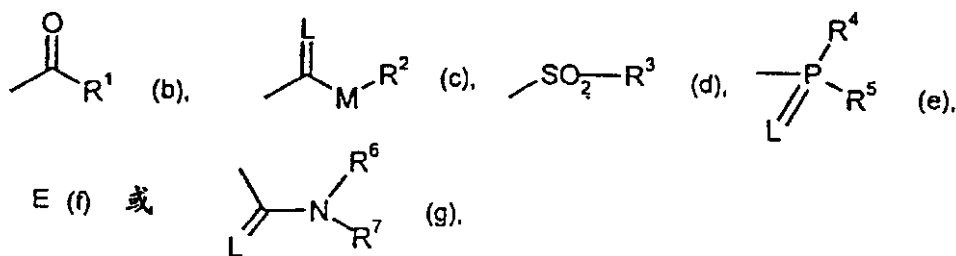
Q^3 表示氢、甲基、乙基或其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代

的 C_3-C_6 -环烷基，或

Q^3 和 Q^4 与其连接的碳原子一起表示一个任选地由甲基-或甲氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的饱和的 C_5-C_6 -环，

G 表示氢(a)或表示下列基团之一：

5



其中

E 表示金属离子或铵离子，

L 表示氧或硫，和

10

M 表示氧或硫，

15

R^1 表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{14} -烷基、 C_2-C_{14} -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、多- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基或任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、丙基-、异丙基-、丁基-、异丁基-、叔丁基-、甲氧基-、乙氧基-、正丙氧基-或异丙氧基-取代的 C_3-C_6 -环烷基，该环烷基中任选地一或二个不直接相邻的环成员由氧和/或硫替代，

表示任选氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的苯基，

20

表示任选氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苄基，

表示均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-或乙基-取代的呋喃基、噻吩基、吡啶基、嘧啶基、噻唑基或吡唑基，

25 或

表示任选由氟-、氯-、氟基-、甲基-或乙基-取代的吡啶氧基- C_1-C_2 -烷基、嘧啶氧基- C_1-C_2 -烷基或噻唑氧基- C_1-C_2 -烷基，

R^2 表示均可任选由氟-取代的 C_1-C_{14} -烷基、 C_2-C_{14} -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基或多- C_1-C_4 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基，

表示任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-或甲氧基-取代的 C_3-C_6 -环烷基，

- 5 或表示均可任选由氟-、氯-、氟基-、硝基-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苯基或苄基，

R^3 表示均可任选由氟-取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基或均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、叔丁基-、甲氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基，

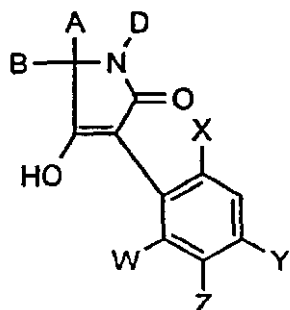
- 10 R^4 和 R^6 相互独立地各表示 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- $(C_1-C_4$ -烷基)氨基、 C_1-C_4 -烷硫基，或表示均可任选由氟-、氯-、溴-、硝基-、氟基-、 C_1-C_2 -烷氧基-、 C_1-C_2 -氟代烷氧基-、 C_1-C_2 -烷硫基-、 C_1-C_2 -氟代烷硫基-或 C_1-C_3 -烷基-取代的苯基、苯氧基或
- 15 苯硫基，

R^6 和 R^7 相互独立地各表示氢，表示 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_4 -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，表示任选由氟-、氯-、溴-、三氟甲基-、甲基-或甲氧基-取代的苯基，表示任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、三氟甲基-或甲氧基-取代的苄基，或一起

20 表示其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_5-C_6 -亚烷基。

5. 制备权利要求 1 的式(I)化合物的方法，其特征在于，

(A) 式(I-1-a)的化合物



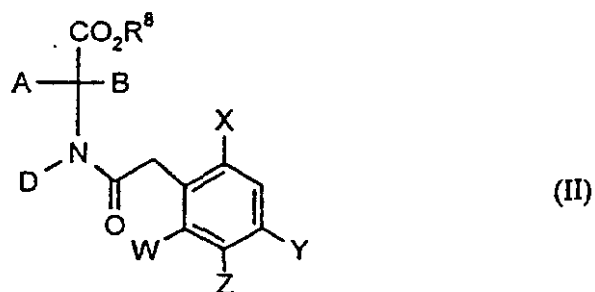
(I-1-a)

25 其中

A、B、D、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义

如下获得

将式 (II) 的 N-酰基氨基酸酯



5 其中

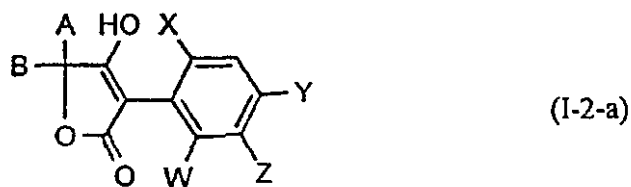
A、B、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

和

R^8 表示烷基

在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合，

10 (B) 式 (I-2-a) 的化合物

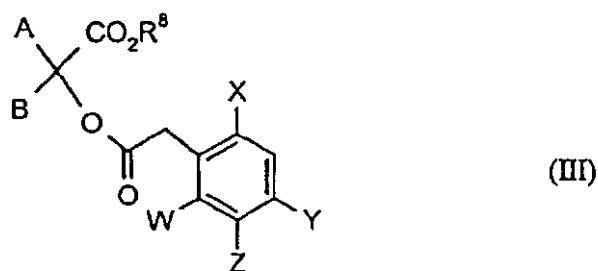


其中

A、B、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

15 如下获得：

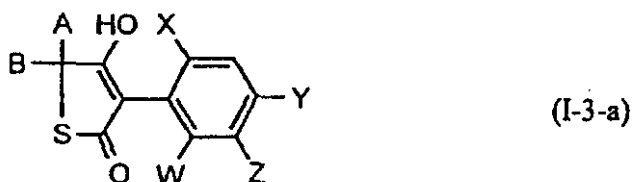
将式 (III) 的羧酸酯



其中

A、B、W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，
在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合，
(C) 式 (I-3-a) 的化合物

5

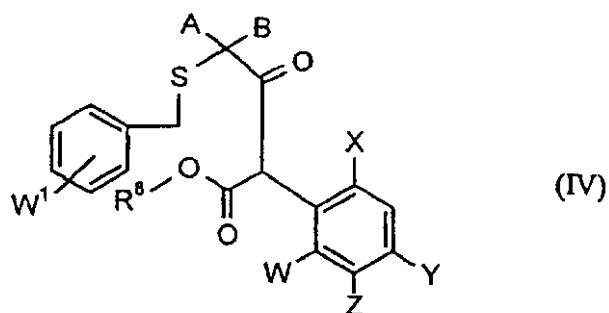


其中

A、B、W、X、Y 和 Z 各如上定义，
如下获得：

10

将式 (IV) 的 β -酮羧酸酯

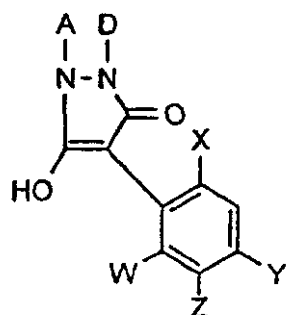


其中

A、B、W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，且
 W^1 表示氢、卤素、烷基或烷氧基，
如果适宜在稀释剂存在下和在酸存在下，进行分子内环化，
(D) 如下获得式 (I-4-a) 的化合物

15

20



(I-4-a)

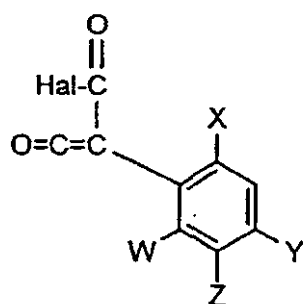
其中

A、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义

5

如下获得:

(α)使式(V)的卤代羧基烯酮



(V)

其中

10

W、X、Y 和 Z 各如上定义,

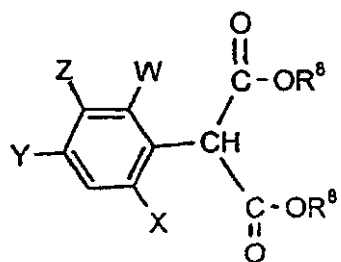
和

Hal 表示卤素

或

(β)使式(VI)的丙二酸衍生物

15



(VI)

其中

R^8 、W、X、Y 和 Z 各如上定义

与式 (VII) 的肼



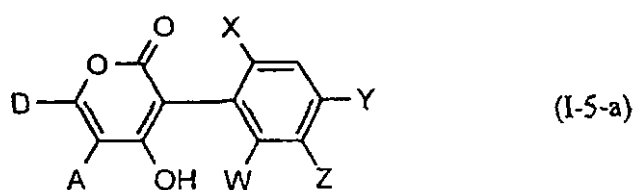
5

其中

A 和 D 各如上定义

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在碱存在下反应,

(E) 式 (I-5-a) 的化合物



10

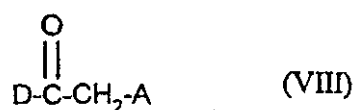
其中

A、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义

如下获得

使式 (VIII) 的羰基化合物

15



其中

A 和 D 各如上定义

或式 (VIIIa) 的其甲硅烷基烯醇醚

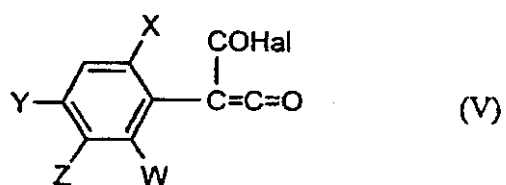
20



其中

A、D 和 R^8 各如上定义

与式 (V) 的烯酮酰基卤



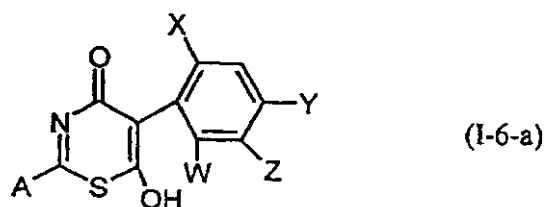
其中

W、X、Y和Z各如上定义，和

5 Hal 表示卤素，

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下反应，

(F) 式 (I-6-a) 的化合物

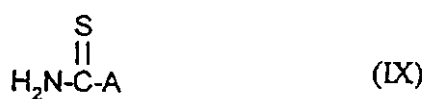


10 其中

A、W、X、Y和Z各如上定义

如下获得

使式 (IX) 的硫代酰胺



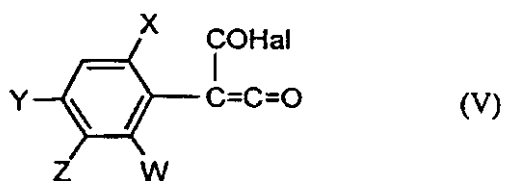
15

其中

A 如上定义

与式 (V) 的烯酮酰基卤

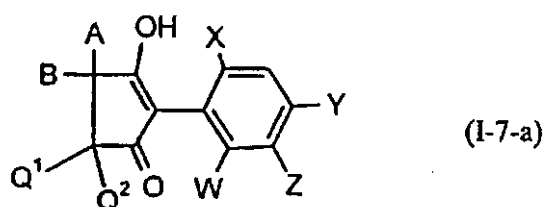
20



其中

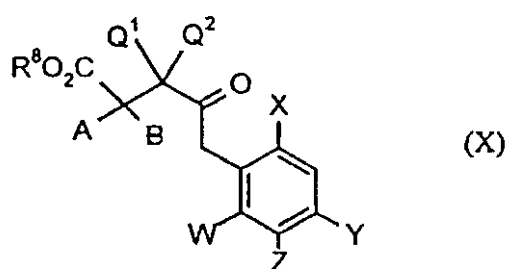
Hal、W、X、Y和Z各如上定义，

- 5 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下反应，
(G) 式(I-7-a)化合物



其中

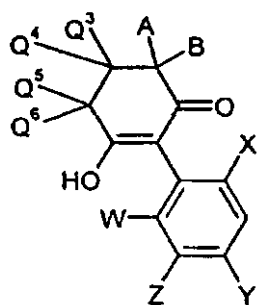
- 10 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义
如下获得
使式(X)的酮羧酸酯



其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y和Z各如上定义，和
R⁸ 表示烷基

- 15 如果适宜在稀释剂存在下和在碱存在下，进行分子内环化，
(H) 式(I-8-a)化合物

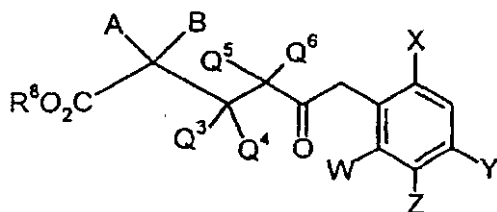


(I-8-a)

其中

5 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义
如下获得

使式(XI)的6-芳基-5-酮基-己酸酯



(XI)

其中

10 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义
和

R⁶ 表示烷基

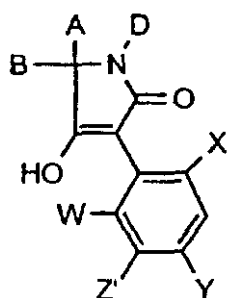
在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合；

或

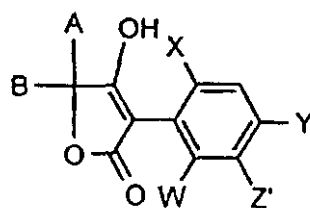
15 (I) 如上所示的式(I-8-a)化合物，其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、
Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、Y和Z各如上定义，如下获得

在溶剂、碱和催化剂存在下，使式(I-1'-a)至(I-8'-a)化合物

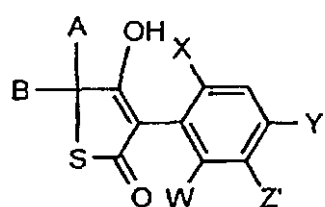
(I-1'-a):



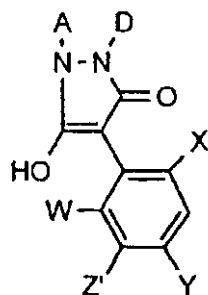
(I-2'-a):



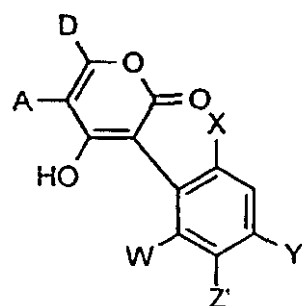
(I-3'-a):



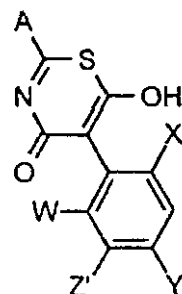
(I-4'-a):



(I-5'-a):

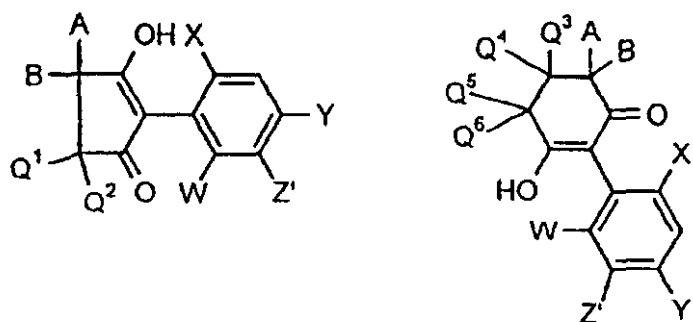


(I-6'-a):



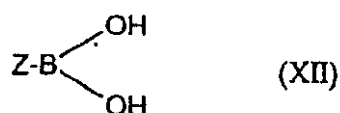
(I-7'-a):

(I-8'-a):



其中

A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X和Y各如上定义，和
Z' 表示氯、溴或碘，
与式(XII)的硼酸反应



其中

Z 如上定义，
随后，所得的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下，
(J α) 与式(XIII)的酰基卤



其中

R¹ 如上权利要求1中所定义，和
Hal 表示卤素
或
(β)与式(XIV)羧酸酐

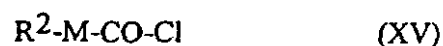


其中

R^1 如上定义,

- 5 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下反应;
或在每一种情况下,

(K) 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 与式 (XV) 的氯代甲酸酯或氯代甲酸硫酯反应



10

其中

R^2 和 M 如权利要求 1 中所定义,

或在每一种情况下,

- 15 (L) 如果适宜在稀释剂存在下, 和如果适宜在酸结合剂存在下,
与式 (XVI) 的氯代单硫代甲酸酯或氯代二硫代甲酸酯反应



其中

M 和 R^2 如上定义,

- 20 或在每一种情况下,

(M) 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下,
与式 (XVII) 的磺酰氯反应



25

其中

R^3 如权利要求 1 中所定义,

或在每一种情况下,

(N) 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下,

5 与式 (XVIII) 的磷化合物反应



其中

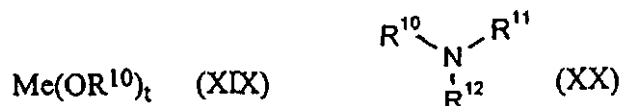
L、 R^4 和 R^5 如权利要求 1 中所定义, 和

10 Hal 表示卤素,

或在每一种情况下,

(O) 如果适宜在稀释剂存在下,

与式 (XIX) 或 (XX) 的金属化合物或胺反应



15

其中

Me 表示单或二价金属, t 表示数字 1 或 2, 和

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 相互独立地各表示氢或烷基,

或在每一种情况下,

20 (P α) 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在催化剂存在下, 与式 (XXI) 的异氰酸酯或异硫氰酸酯反应



其中

25 R^6 和 L 各如权利要求 1 中所定义,

或在每种情况下

(β) 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 与式(XXII)的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯反应

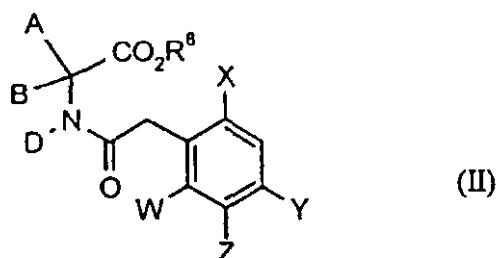


5

其中

L、R⁶和R⁷ 如权利要求1中所定义。

6. 式(II)化合物

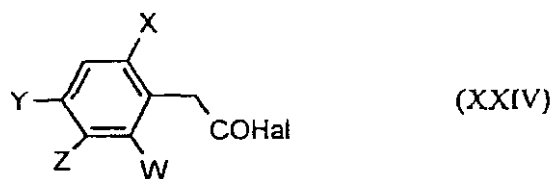


10

其中

A、B、D、W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义, 和R⁸表示烷基。

7. 式(XXIV)化合物



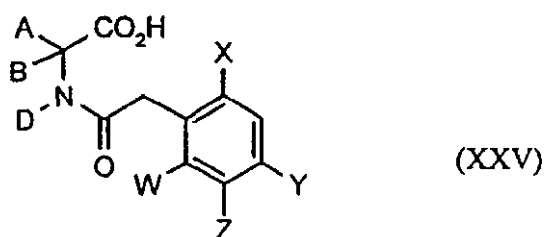
15

其中

W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义, 和Hal表示氯或溴。

8. 式(XXV)化合物

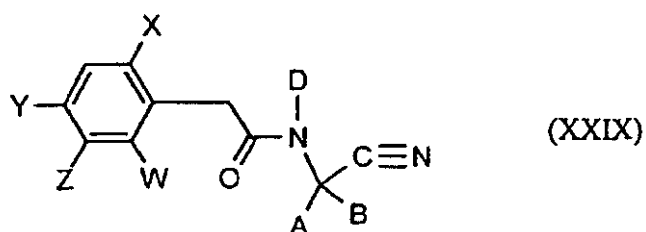
20



其中

A、B、D、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义。

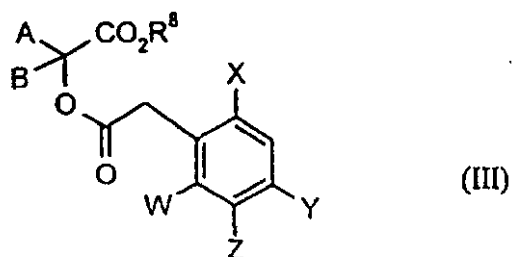
5 9. 式 (XXIX) 化合物



其中

A、B、D、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义。

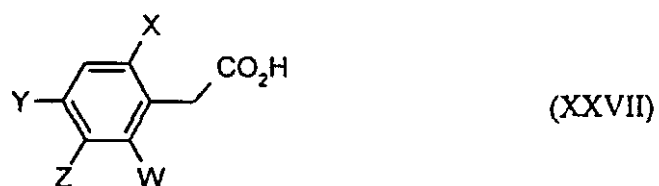
10 10. 式 (III) 化合物



其中

A、B、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义，和 R⁸ 表示烷基。

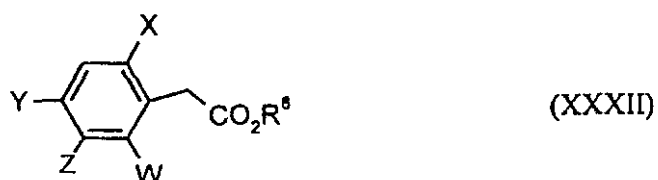
15 11. 式 (XXVII) 化合物



其中

W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义。

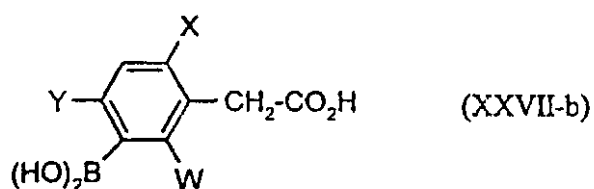
5 12. 式 (XXXII) 化合物



其中

W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义，和
 10 R⁶ 表示烷基。

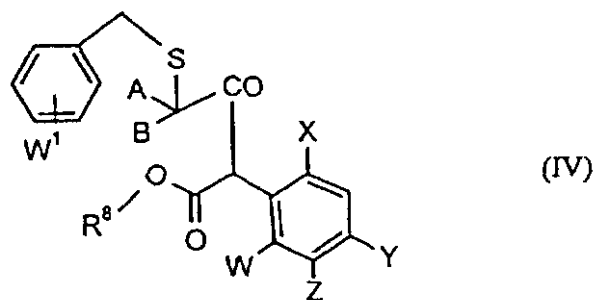
13. 式 (XXVII-b) 化合物



其中

15 W、X 和 Y 各如权利要求 1 中所定义。

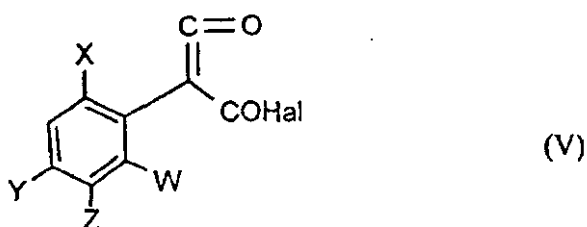
14. 式 (IV) 化合物



其中

A、B、W、W'、X、Y和Z各如权利要求1中所定义，和
R⁸表示烷基。

5 15. 式(V)化合物

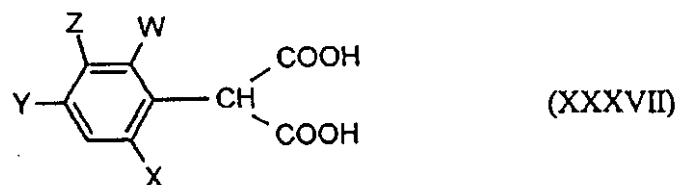


其中

W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义，和
Hal表示氯或溴。

10

16. 式(XXXVII)化合物

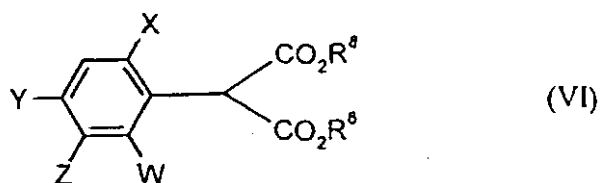


其中

W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义。

15

17. 式(VI)化合物

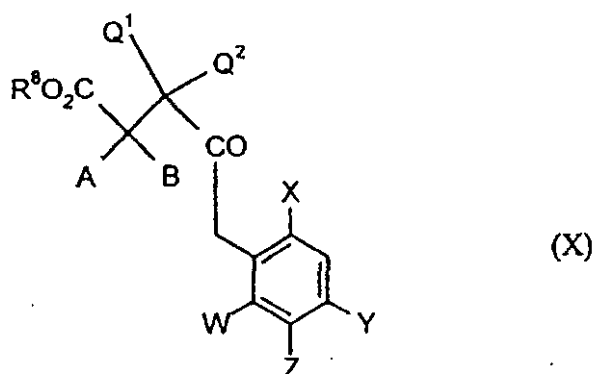


其中

W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义，和
R⁸表示烷基。

5

18. 式(X)化合物

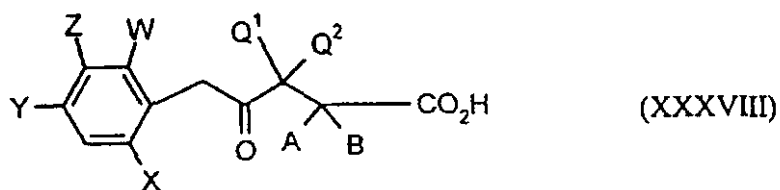


其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义，和
R⁸表示烷基。

10

19. 式(XXXVIII)化合物

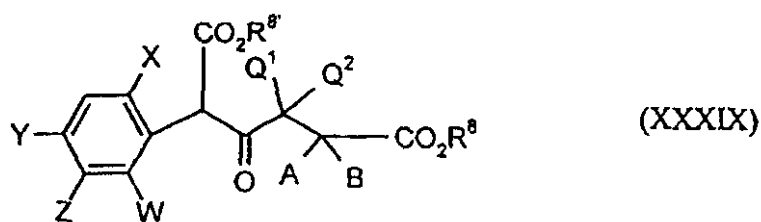


其中

W、X、Y、Z、A、B、Q¹和Q²各如权利要求1中所定义。

20. 式(XXXIX)化合物

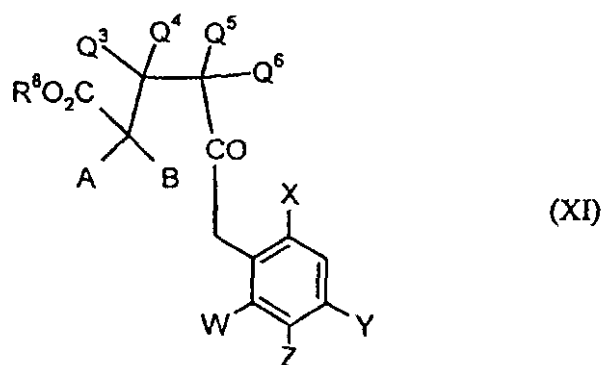
15



其中

5 A、B、D¹、D²、W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义，和
R⁸和R^{8'}表示烷基。

21. 式(XI)化合物

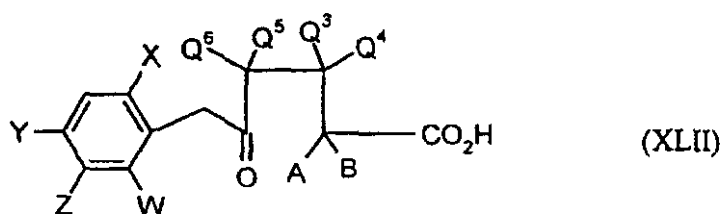


其中

10 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如权利要求1中所定义，
和

R⁸表示烷基。

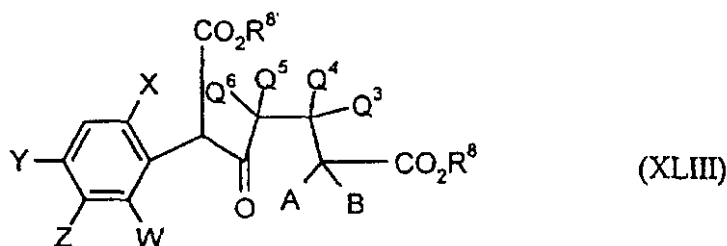
22. 式(XLII)化合物



其中

15 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各权利要求1中所定义。

23. 式 (XLIII) 化合物



其中

- 5 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如权利要求 1 中所定义，
和

R⁸ 和 R^{8'} 表示烷基。

24. 杀虫剂和/或除草剂，其特征在于，它们含有至少一种权利要求 1 的式 (I) 化合物。

- 10 25. 权利要求 1 的式 (I) 化合物在作物保护、家居方面、卫生方面和贮存产品的保护上防治有害生物的应用。

26. 在作物保护、家居方面、卫生方面和贮存产品的保护上防治有害生物的方法，其特征在于，使权利要求 1 的式 (I) 化合物作用于有害生物和/或其栖生地。

- 15 27. 制备杀虫剂和/或除草剂的方法，其特征在于，将权利要求 1 的式 (I) 化合物与扩充剂和/或表面活性剂混合。

说明书

芳基苯基取代的环状酮烯醇类化合物

本发明涉及新的芳基苯基-取代的环状酮烯醇类, 涉及其多种制备
5 方法及其作为杀虫剂和除草剂的应用。

3-酰基-吡咯烷-2, 4-二酮类的药物性能已有过报道 (S. Suzuki
等, 《化学药物公报》[Chem. Pharm. Bull.]15, 1120(1967)). 再
者, R. Schmierer 和 H. Mildenberger 合成了 N-苯基吡咯烷-2, 4-二
10 酮类 (Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095). 未曾描述这些化合物的生
物活性。

EP-A-0 262 399 和 GB-A-2 266 888 公开了相似结构的化合物 (3-
芳基-吡咯烷-2, 4-二酮类), 然而, 它们的除草、杀虫或杀螨活性是
未知的。未取代的双环状 3-芳基-吡咯烷-2, 4-二酮衍生物 (EP-A-355
599 和 EP-415 211) 和取代的单环状 3-芳基-吡咯烷-2, 4-二酮衍生物
15 (EP-A-377 893 和 EP-442 077) 具有除草、杀虫或杀螨活性是已知的。

同样已知的还有多环状 3-芳基吡咯烷-2, 4-二酮衍生物 (EP-442
073) 和 1H-芳基吡咯烷-二酮衍生物 (EP-456 063、EP-521 334、EP-
596 298、EP-613 884、EP-613 885、WO 94 / 01 997、WO 95 / 26 954、
WO 95 / 20 572、EP-A-0 668 267、WO 96 / 25 395、WO 96 / 35 664、
20 WO 97 / 01 535、WO 97 / 02243 和 WO 97 / 36 868、DE-19 716 591)。

已知某些取代的 Δ^3 -二氢呋喃-2-酮衍生物具有除草性能 (参见,
DE-A-4 014 420)。季酮酸衍生物用作起始原料的合成 (例如, 3-(2-
甲基-苯基)-4-羟基-5-(4-氟苯基)- Δ^3 -二氢呋喃-2-酮) 同样描述于
DE-A-4 014 420 中。类似结构的化合物由 Campbell 等发表于 J. Chem.
25 Soc., Perkin Trans. 1, 1985, (8)1567-76 中的文献已知, 但未提
到杀虫和 / 或杀螨活性。再者, 具有除草、杀螨和杀虫性能的 3-芳基
- Δ^3 -二氢呋喃酮衍生物由 EP-A-528 156、EP-A-0 647 637、WO 95
/ 26 345、WO 96 / 20 196、WO 96 / 25 395、WO 96 / 35 664、WO 97
/ 01 535、WO 97 / 02243 和 WO 97 / 36 868、DE-19 716 591 已知。
30 3-芳基- Δ^3 -二氢噻吩-酮衍生物同样是已知的 (WO 95 / 26 345、WO 96
/ 25 395、WO 97 / 01 535、WO 97 / 02243、WO 97 / 36 868、DE-19
716 591)。

同样由文献已知的还有某些 3H-吡唑-3-酮衍生物, 例如, 1,2-二乙基-1,2-二氢-5-羟基-4-苯基-3H-吡唑-3-酮或 {[5-氧代-1,2-二苯基-4-(对磺基苯基)-3-吡唑啉-3-基]-氧基}二钠盐, 或对-(3-羟基-5-氧代-1,2-二苯基-3-吡唑啉-4-基)-苯磺酸(参见,《杂环化学杂志》[J. Heterocycl. Chem.]25(5), 1301-1305, 1988 或《杂环化学杂志》[J. Heterocycl. Chem.], 25(5), 1307-1310, 1988 或 Zh. Obshch. Khim., 34(7), 2397-2402, 1964)。然而, 未曾描述这些化合物的生物活性。

再者, 已知 4,4',4''-(5-羟基-3-氧代-1H-吡唑-1,2,4(3H)-三基)-三-苯磺酸三钠具有药物性能(参见, Farmakol. Toksikol. (莫斯科), 38(2), 180-186, 1976)。然而, 未见用在作物保护上。

而且, EP-508 126 和 WO 92/16 510、WO 96/21 652 描述了 4-芳基吡咯烷-3,5-二酮衍生物具有除草、杀螨和杀虫性能。此外, 4-芳基吡唑烷类是已知的, 其杀真菌性能曾有过描述(WO 96/36 229、WO 96/36 615、WO 96/36 616、WO 96/36 633)。

某些在苯环上未取代的苯基-吡喃酮衍生物是已知的(参见, A. M. Chirazi, T. Kappe & E. Ziegler, Arch. Pharm. 309 558(1976) 和 K.-H. Boltze 和 K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849)。未提到这些化合物作为农药使用的可能。在苯环上被取代且具有除草、杀螨和杀虫作用的苯基吡喃酮衍生物描述于 EP-A-588 137、WO 96/25 395、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02 243、WO 97/16 436、WO 97/19 941、WO 97/36 868 和 DE-19 716 591。

某些在苯环上未取代的 5-苯基-1,3-噻嗪衍生物也是已知的(参见, E. Ziegler 和 E. Steiner, Monatsh. 95, 147(1964), R. Ketcham, T. Kappe 和 E. Ziegler,《杂环化学杂志》[J. Heterocycl. Chem.] 10, 223(1973), 未提到这些化合物作为农药使用的可能。在苯环上取代且具有除草、杀螨和杀虫活性的 5-苯基-1,3-噻嗪描述于 WO 94/14 785、WO 96/02 539、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02 243、WO 97/02 243、WO 97/36 868 中。

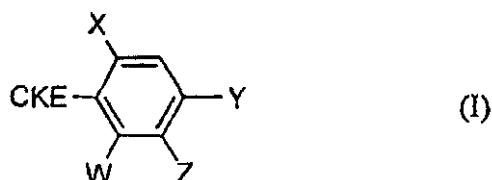
已知某些取代的 2-芳基环戊烷二酮具有除草和杀螨性能(参见, 例如, US-4 283 348; 4 338 122; 4 436 666; 4 526 723; 4 551 547; 4 632 698; WO 96/01 798; WO 96/03 366 和 WO 97/14 667)。而且,

相似结构的化合物是已知的：3-羟基-5, 5-二甲基-2-苯基环戊-2-烯-1-酮, 由Micklefield等发表于《四面体》[Tetrahedron], (1992), 7519-26 和天然产物 involutine (-)-顺-5-(3, 4-二羟基苯基)-3, 4-二羟基-2-(4-羟基苯基)-环戊-2-烯-酮, 由 Edwards 等发表于 J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9. 未描述杀虫和杀螨活性。而且, 2-(2, 4, 6-三甲基苯基)-1, 3-二氢化茚二酮, 发表于《经济昆虫学杂志》[J. Economic Entomology] 66, (1973), 584 和德国专利公开 DE-2 361 084, 提到除草和杀螨活性。

已知某些取代的 2-芳基环己二酮具有除草和杀螨性能(US-4 175 135, 4 209 432, 4 256 657, 4 256 658, 4 256 659, 4 257 858, 4 283 348, 4 303 669, 4 351 666, 4 409 153, 4 436 666, 4 526 723, 4 613 617, 4 659 372, DE-2 813 341, 以及 Wheeler, T.N., 《有机化学杂志》[J. Org. Chem.], 44, 4906(1979)).

然而, 这些化合物的活性与活性谱, 特别是在低施用剂量和浓度下, 并不总是完全令人满意的。再者, 这些化合物与植物相适性不总是令人满意的。

因此, 本发明提供新的式(I)化合物



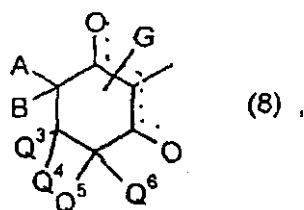
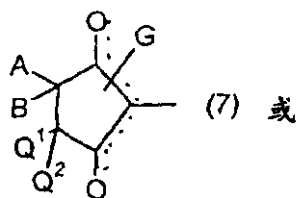
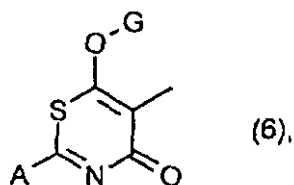
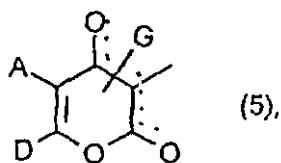
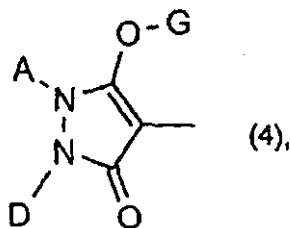
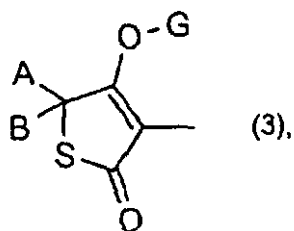
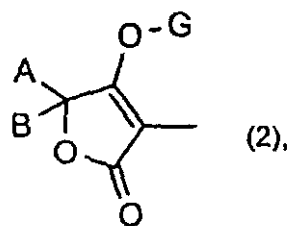
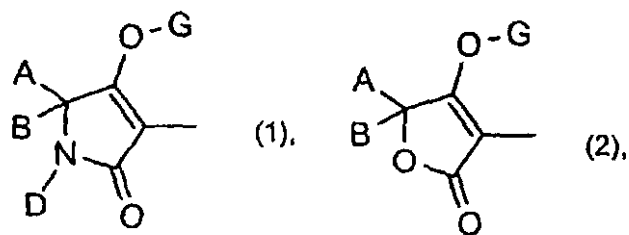
其中

X 表示卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基、氰基或均任选被取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苯基烷氧基或苯基烷硫基,

Z 表示均可任选取代的环烷基、芳基或杂芳基,

W 和 Y 相互独立地各表示氢、卤素、烷基、烷氧基、链烯氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、硝基或氰基,

CKE 表示下列基团之一:



其中

- A 表示氢，均任选由卤素取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷硫基烷基、饱和或不饱和的任选至少一个环原子由杂原子替代的任选取代的环烷基，或均任选由卤素-、烷基-、卤代烷基-、烷氧基-、卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的芳基、芳烷基或杂芳基，

B 表示氢、烷基或烷氧基烷基，或

- 10 A 和 B 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的未取代或取代的环，该环任选地含有至少一个杂原子，

D 表示氢或一个任选取代的选自下列的基团：烷基、链烯基、

炔基、烷氧基烷基、多烷氧基烷基、烷硫基烷基、饱和或不饱和的有一或多个环成员任选地由杂原子替代的环烷基，芳烷基、芳基、杂芳基烷基或杂芳基，或

- 5 A 和 D 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的环，该环在 A、D 部分是未取代或取代的且它任选地含有至少一个(在其中 CKE - (4)的情况下另外的)杂原子，或

A 和 Q¹ 一起表示烷二基或链烯二基，它们各任选由在每种情况下均为任选取代的烷基、羟基、烷氧基、烷硫基、环烷基、苄氧基或芳基取代，或

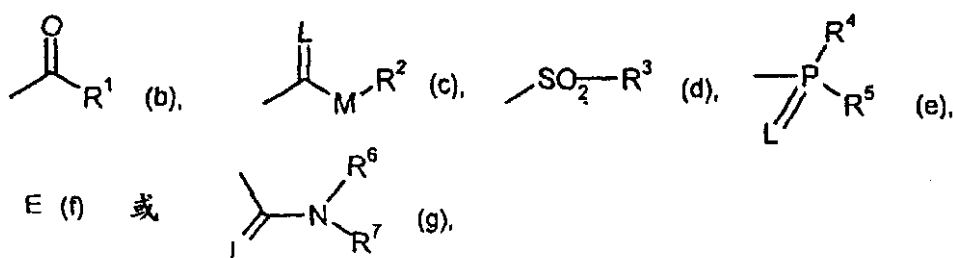
- 10 Q¹ 表示氢或烷基，

Q²、Q⁴、Q⁵ 和 Q⁶ 相互独立地各表示氢或烷基，

Q³ 表示氢、烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、任选取代的环烷基(其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代)或任选取代的苯基，或

- 15 Q³ 和 Q⁴ 与其连接的碳原子一起表示一个饱和或不饱和的未取代或取代的任选地含有杂原子的环，

G 表示氢(a)或表示下列基团之一：



其中

- 20 E 表示金属离子或铵离子，

L 表示氧或硫，

M 表示氧或硫，

- 25 R¹ 表示均任选由卤素-取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、多烷氧基烷基或任选由卤素-、烷基-或烷氧基-取代的可以间入至少一个杂原子的环烷基，均任选取代的苯基、苯基烷基、杂芳基、苄氧基烷基或杂芳氧基烷基，

R² 表示均任选由卤素-取代的烷基、链烯基、烷氧基烷基、多烷

氧基烷基或表示均任选取代的环烷基、苯基或苄基，

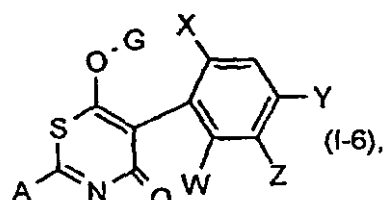
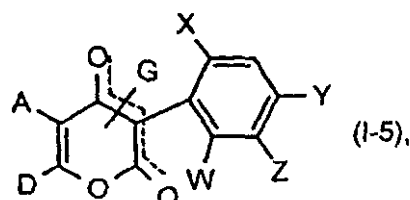
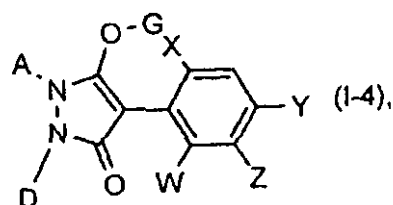
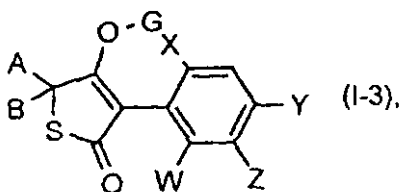
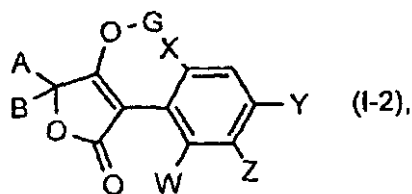
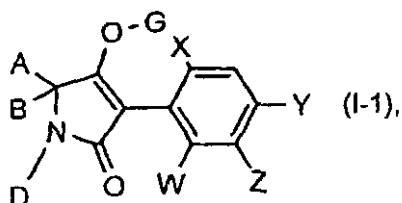
R^3 、 R^4 和 R^5 相互独立地各表示均任选由卤素取代的烷基、烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、链烯硫基、环烷基硫基或表示均任选取代的苯基、苄基、苯氧基或苯硫基，和

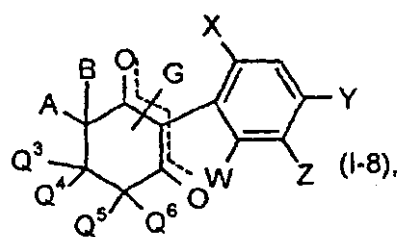
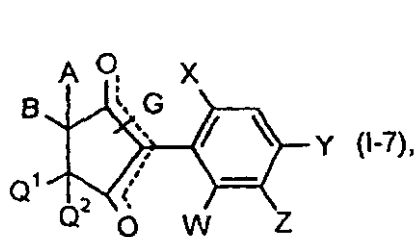
- 5 R^6 和 R^7 相互独立地各表示氢，均任选由卤素取代的烷基、环烷基、链烯基、烷氧基、烷氧基烷基，表示任选取代的苯基，表示任选取代的苄基，或与其连接的氮原子一起表示一个任选间入氧或硫的环。

10 取决于特别是取代基的性质，式(I)化合物可以以各种组成的几何和/或光学异构体或异构体混合物存在，如果需要，它们可以用常规方式分离。本发明提供纯异构体和异构体混合物，其制备和应用以及包含它们的组合物。然而，在下文中，为简明起见，总是提到式(I)化合物，虽然是要包括纯化合物和如果适宜具有不同比例的异构体化合物的混合物二者。

包括基团 CKE 的含意(1)至(8)，产生下列主结构(I-1)至(I-8)：

15



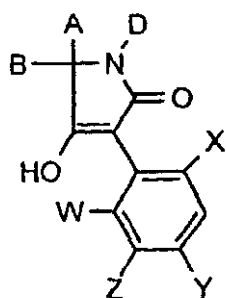


其中

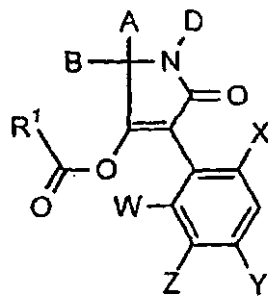
A、B、D、G、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义。

- 5 包括基团G的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，
如果CKE表示基团(1)，则产生下列主结构(I-1-a)至(I-1-g)，

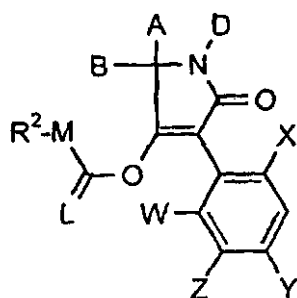
(I-1-a):



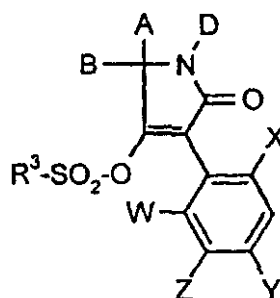
(I-1-b):



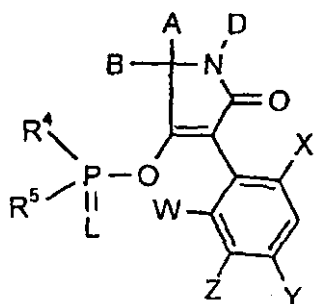
(I-1-c):



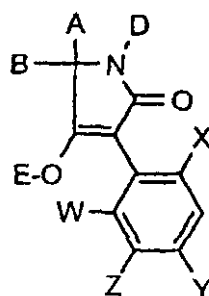
(I-1-d):



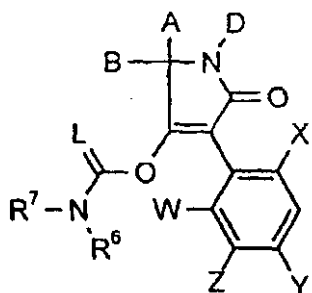
(I-1-e):



(I-1-f):



(I-1-g):

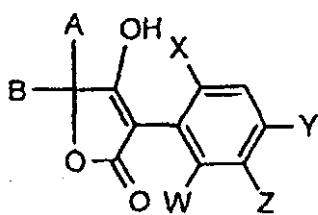


其中

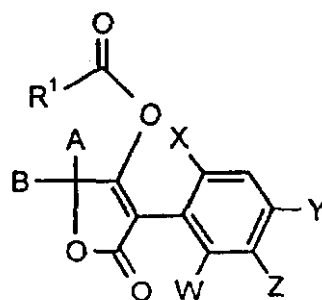
A、B、D、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上
5 定义。

包括基团 G 的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g),
如果 CKE 表示基团(2), 则产生下列主结构(I-2-a)至(I-2-g),

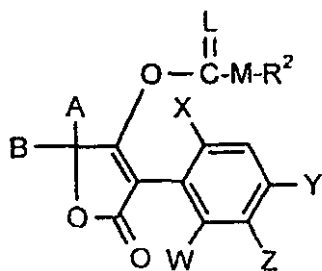
(I-2-a):



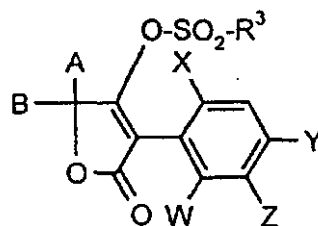
(I-2-b):



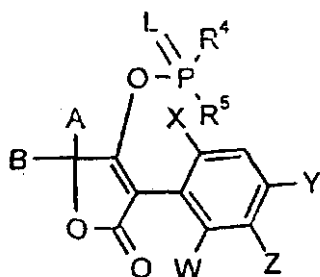
(I-2-c):



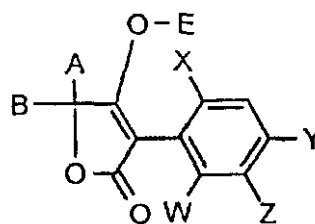
(I-2-d):



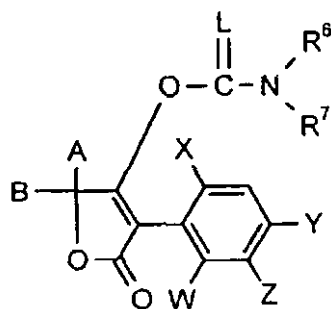
(I-2-e):



(I-2-f):



(I-2-g):

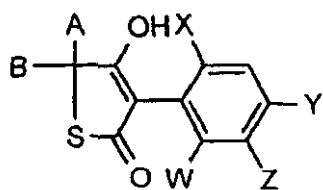


其中

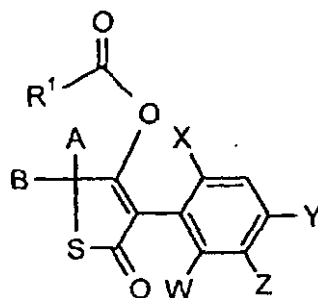
A、B、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

包括基团G的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，
如果CKE表示基团(3)，则产生下列主结构(I-3-a)至(I-3-g)，

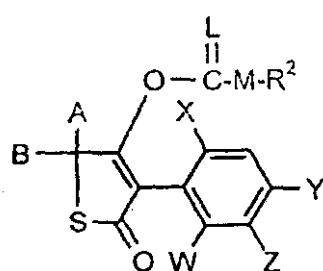
(I-3-a):



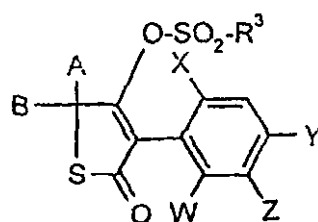
(I-3-b):



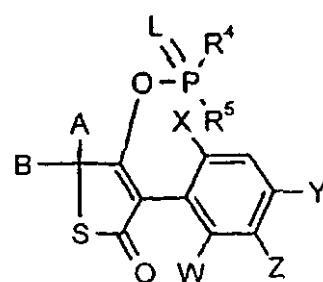
(I-3-c):



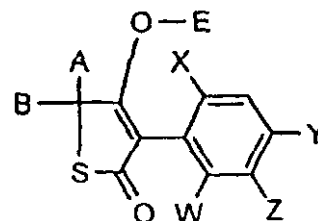
(I-3-d):



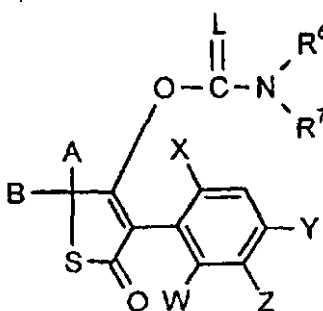
(I-3-e):



(I-3-f):



(I-3-g):

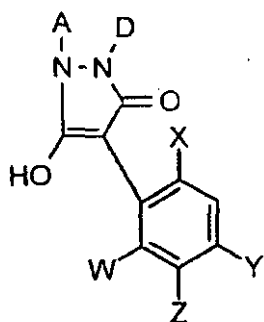


其中

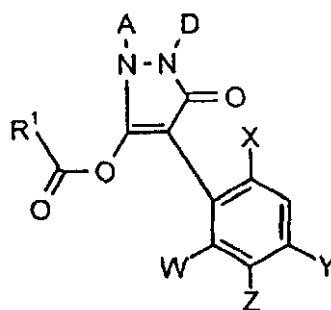
- 5 A、B、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

包括基团 G 的各种含意 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g),
如果 CKE 表示基团 (4), 则产生下列主结构 (I-4-a) 至 (I-4-g),

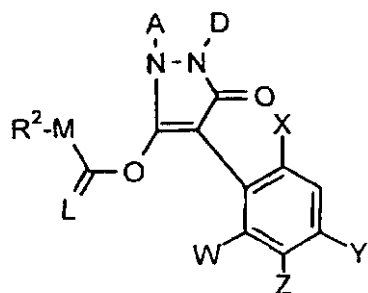
(I-4-a):



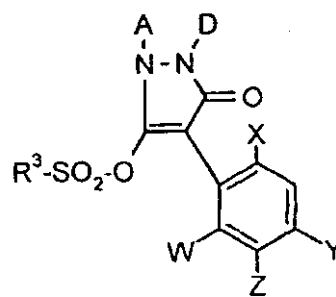
(I-4-b):



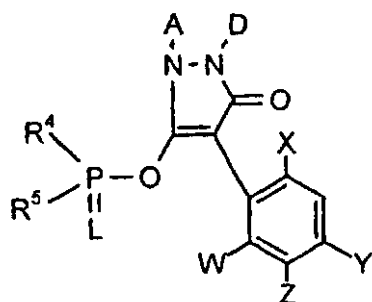
(I-4-c):



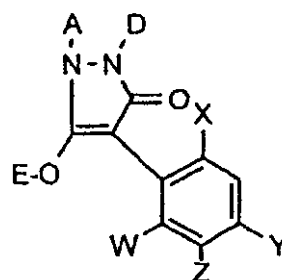
(I-4-d):



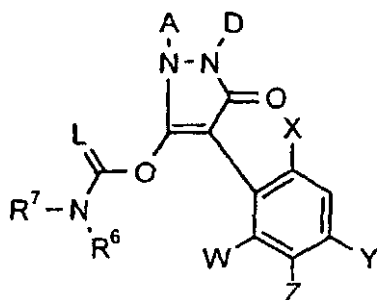
(I-4-e):



(I-4-f):



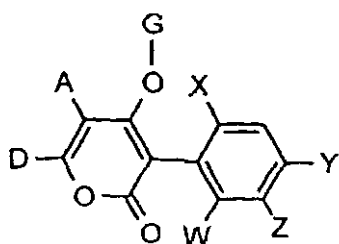
(I-4-g):



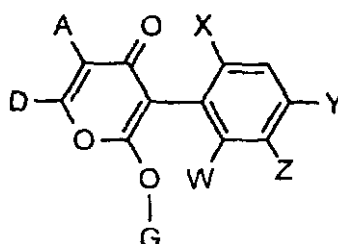
其中

5 A、D、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

取决于取代基G的位置，式(I-5)化合物可以以式(I-5-A)和(I-5-B)这二种异构体形式存在，



(I-5-A)



(I-5-B)

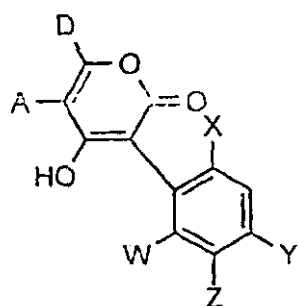
10 它将由式中(I-5)的虚线表示。

式(I-5-A)和(I-5-B)化合物可以以混合物或其纯异构体形式存在。式(I-5-A)和(I-5-B)化合物的混合物如果需要可以用本身已知的方式通过物理方法例如用色谱法分离。

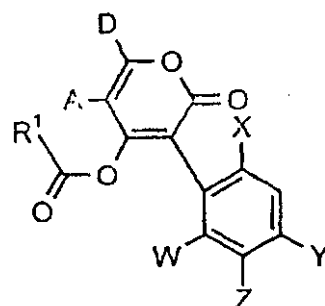
15 为简明起见，下文在每一种情况下只给出一种可能的异构体。这并不排除化合物如果适宜可以以异构体混合物或对应的另一种异构体形式存在。

包括基团G的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，如果CKE表示基团(5)，则产生下列主结构(I-5-a)至(I-5-g)，

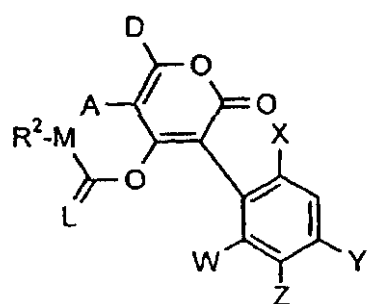
(I-5-a):



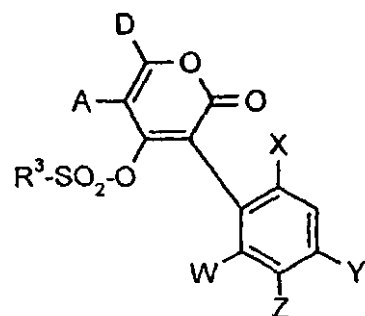
(I-5-b):



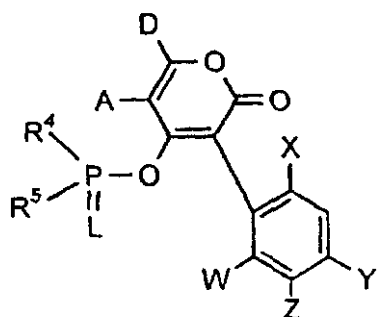
(I-5-c):



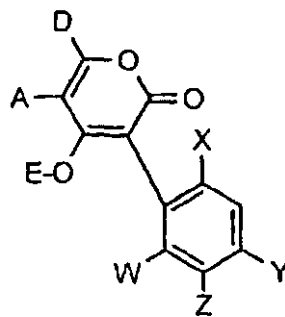
(I-5-d):



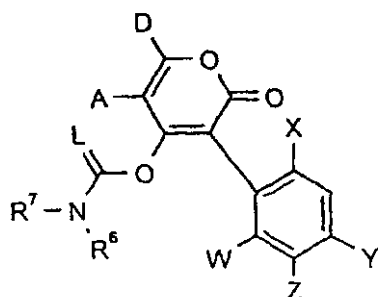
(I-5-e):



(I-5-f):



(I-5-g):



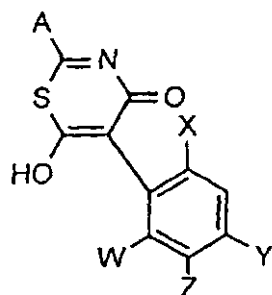
其中

A、D、E、L、M、W、X、Y、Z、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 R^7 各如上定义。

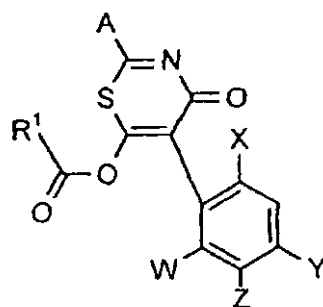
包括基团 G 的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，
如果 CKE 表示基团(6)，则产生下列主结构(I-6-a)至(I-6-g)，

5

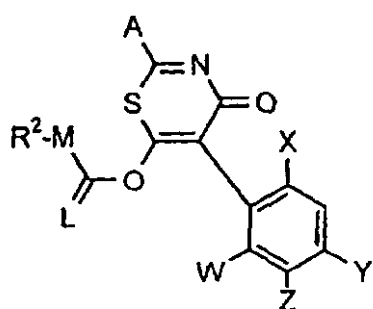
(I-6-a):



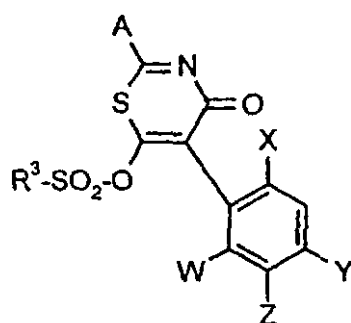
(I-6-b):



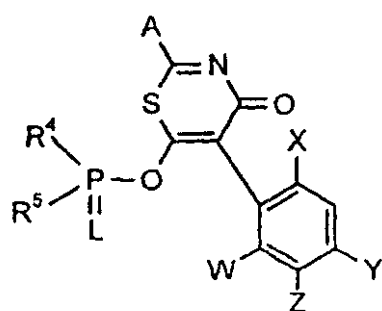
(I-6-c):



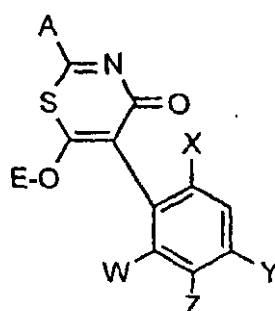
(I-6-d):



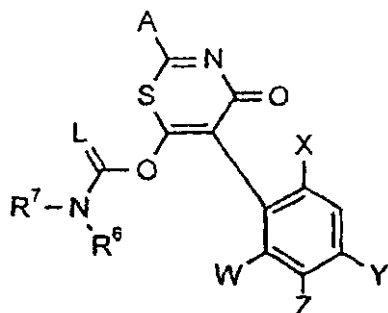
(I-6-e):



(I-6-f):



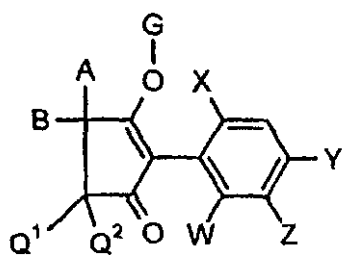
(I-6-g):



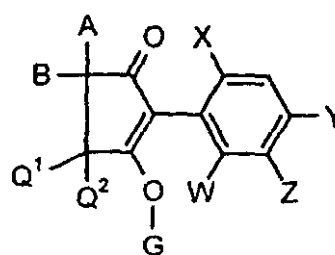
其中

A、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷各如上定义。

- 5 取决于取代基G的位置，式(I-7)化合物可以以式(I-7-A)和(I-7-B)这二种异构体形式存在，



(I-7-A)



(I-7-B)

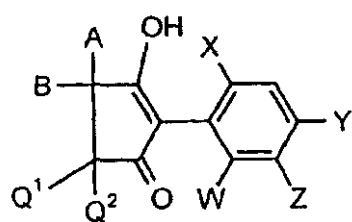
它将由式中(I-7)的虚线表示。

- 10 式(I-7-A)和(I-7-B)化合物可以以混合物或其纯异构体形式存在。式(I-7-A)和(I-7-B)化合物的混合物如果需要可以用本身已知的方式通过物理方法例如用色谱法分离。

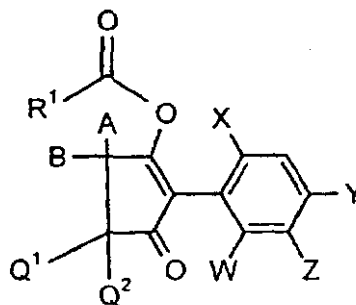
为简明起见，下文在每一种情况下只给出一种可能的异构体。这并不排除化合物如果适宜可以以异构体混合物或对应的另一种异构体形式存在。

- 15 包括基团G的各种含意(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)和(g)，产生下列主结构(I-7-a)至(I-7-g)，

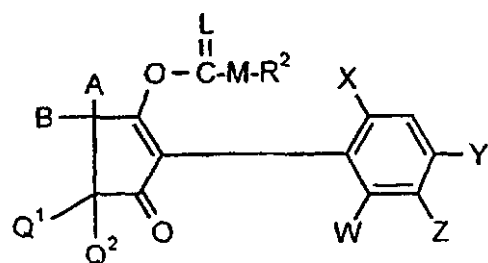
(I-7-a):



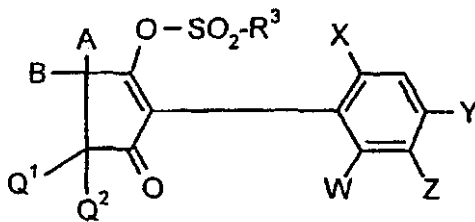
(I-7-b):



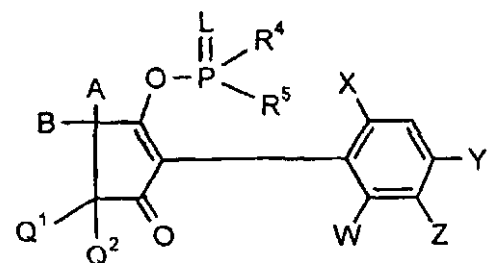
(I-7-c):



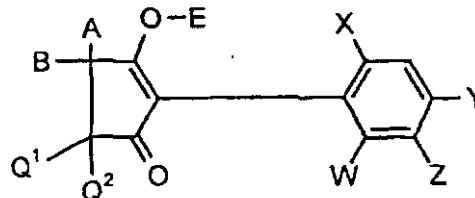
(I-7-d):



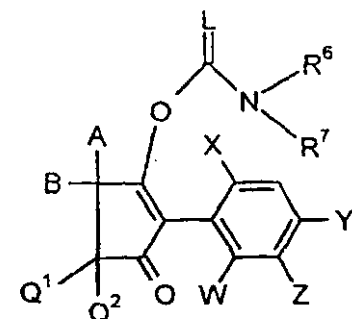
(I-7-e):



(I-7-f):



(I-7-g):

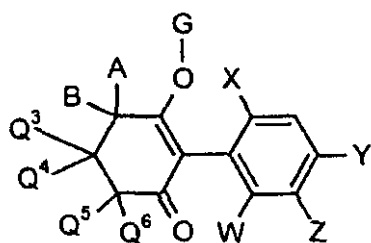


其中

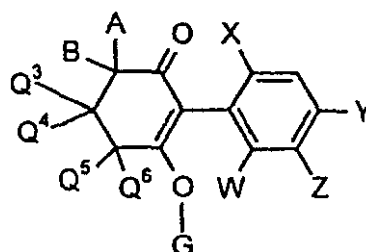
5 A、B、Q¹、Q²、E、L、M、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和R⁷

各如上定义。

取决于取代基 G 的位置，式 (I-8) 化合物可以以式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 这二种异构体形式存在，



(I-8-A)



(I-8-B)

5

它将由式中 (I-8) 的虚线表示。

式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 化合物可以以混合物或其纯异构体形式存在。式 (I-8-A) 和 (I-8-B) 化合物的混合物如果需要可以用本身已知的方式通过物理方法例如用色谱法分离。

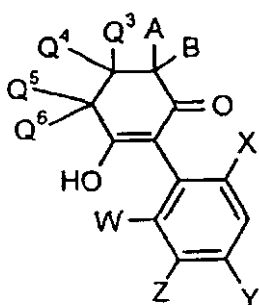
10

为简明起见，下文在每一种情况下只给出一种可能的异构体。这并不排除化合物如果适宜可以以异构体混合物或对应的另一种异构体形式存在。

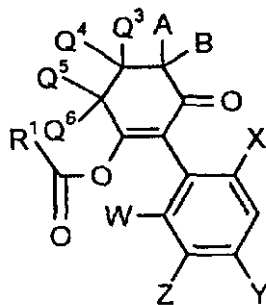
包括基团 G 的各种含意 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) 和 (g)，产生下列主结构 (I-8-a) 至 (I-8-g)，

15

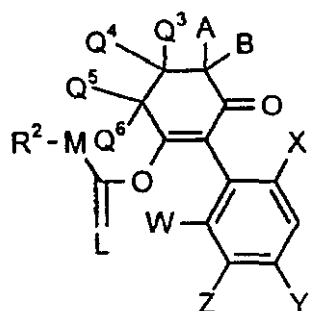
(I-8-a):



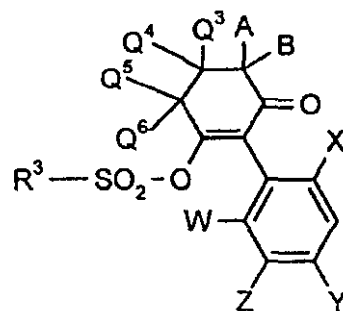
(I-8-b):



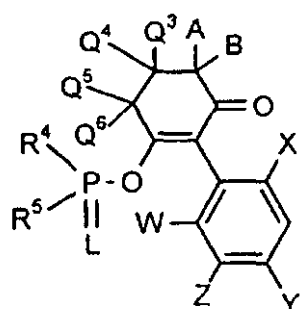
(I-8-c):



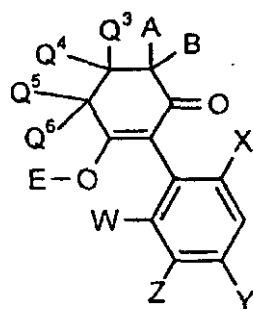
(I-8-d):



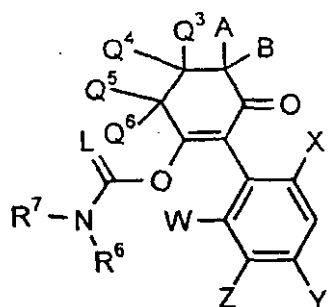
(I-8-e):



(I-8-f):



(I-8-g):

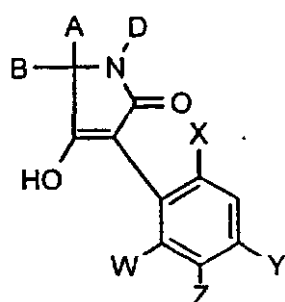


其中

A、B、E、L、M、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、
5 R⁶和R⁷各如上定义。

再者，业已发现，新的式(I)化合物通过如下方法之一获得：

(A) 式(I-1-a)的取代的3-苯基吡咯烷-2,4-二酮或其烯醇



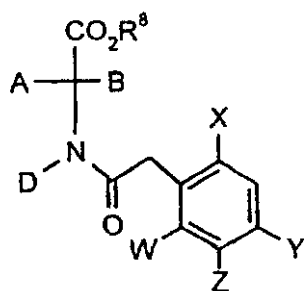
(I-1-a)

其中

A、B、D、W、X、Y和Z各如上定义，

5 如下获得：

将式(II)的 N-酰基氨基酸酯



(II)

其中

10 A、B、D、W、X、Y和Z各如上定义，

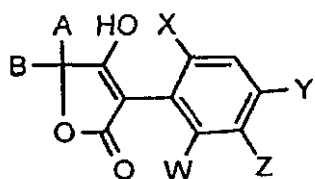
和

R^8 表示烷基(优选 C_1-C_6 -烷基)，

在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合。

(B) 此外，还发现，式(I-2-a)的取代的 3-苯基-4-羟基- Δ^3 -二羟基

15 呋喃酮衍生物



(I-2-a)

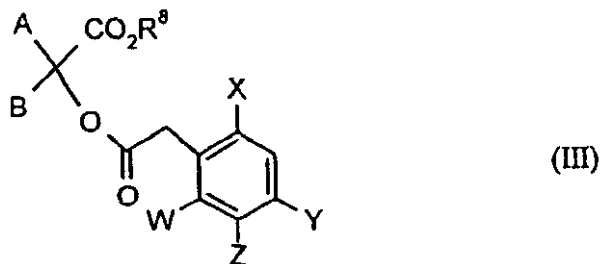
其中

A、B、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如下获得：

将式 (III) 的羧酸酯

5

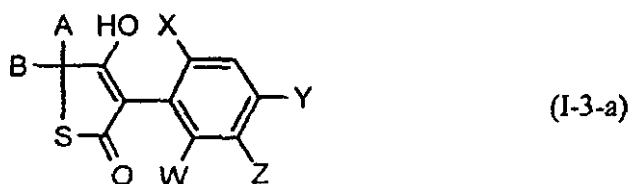


其中

A、B、W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，

在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合。

- 10 (C) 而且还发现，式 (I-3-a) 的取代的 3-苯基-4-羟基- Δ^3 -二羟基噻吩酮衍生物

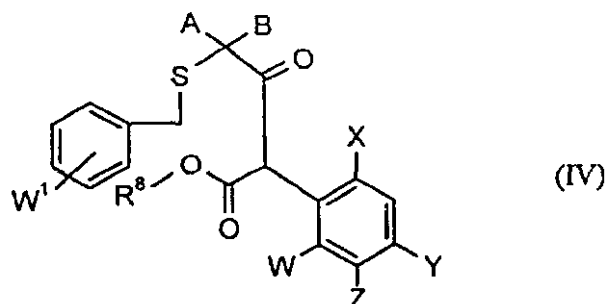


其中

- 15 A、B、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如下获得：

将式 (IV) 的 β -酮羧酸酯



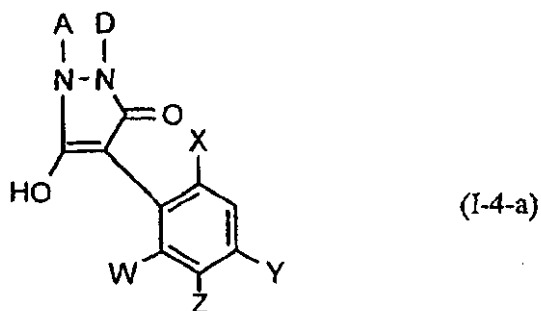
其中

A、B、W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，且

- 5 W' 表示氢、卤素、烷基(优选 C_1-C_6 -烷基)或烷氧基(优选 C_1-C_8 -烷氧基)

如果适宜在稀释剂存在下和在酸存在下，进行分子内环化。

(D) 式(I-4-a)的 3-羟基-4-苯基-5-氧代-吡咯啉

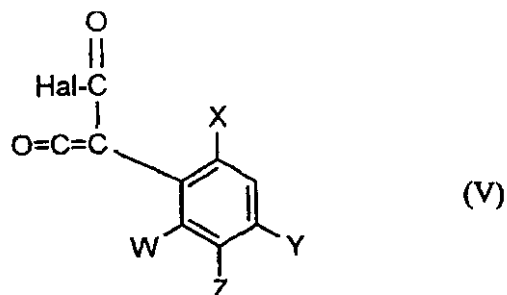


10 其中

A、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如下获得：

(α) 使式(V)的卤代羰基烯酮



其中

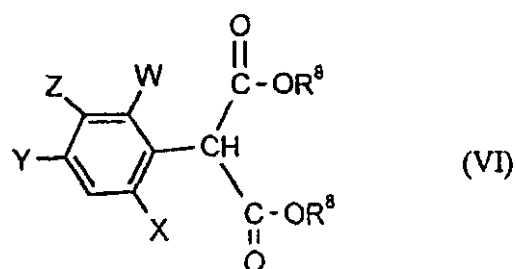
W、X、Y 和 Z 各如上定义，

和

Hal 表示卤素(特别是氯或溴)，

5 或

(β) 使式 (VI) 的丙二酸衍生物



其中

10 R^8 、W、X、Y 和 Z 各如上定义

与式 (VII) 的肼

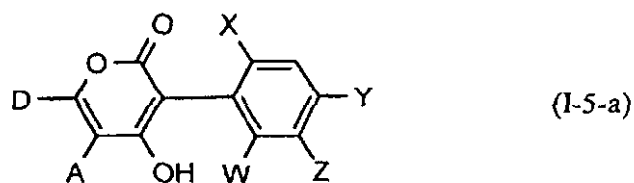


其中

A 和 D 各如上定义

15 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在碱存在下反应。

(E) 再者还发现，新的式 (I-5-a) 的取代的 3-苯基吡喃酮衍生物

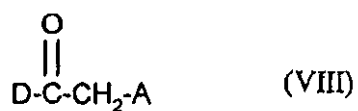


其中

20 A、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如下获得：

使式 (VIII) 的羰基化合物



其中

A 和 D 各如上定义,

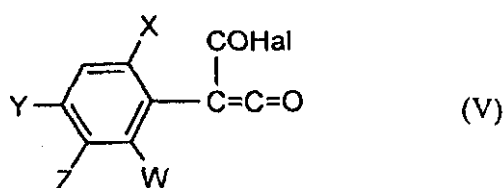
5 或式 (VIIIa) 的其甲硅烷基烯醇醚



其中

A、D 和 R^8 各如上定义,

10 与式 (V) 的烯酮酰基卤



其中

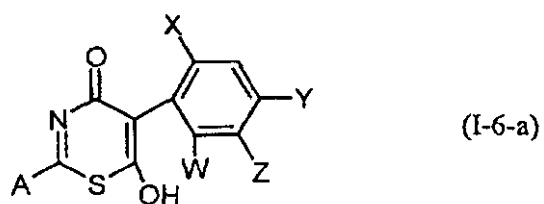
W、X、Y 和 Z 各如上定义, 和

15 Hal 表示卤素 (优选表示氯或溴),

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下反应,

再者, 还发现

(F) 式 (I-6-a) 的新的取代的苯基-1,3-噻嗪衍生物



其中

A、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如下获得：

使式 (IX) 的硫代酰胺

5

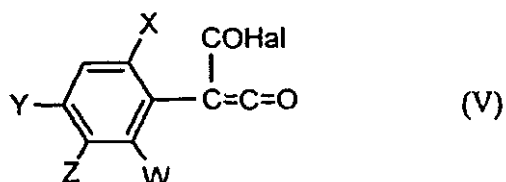


其中

A 如上定义，

与式 (V) 的烯酮酰基卤

10



其中

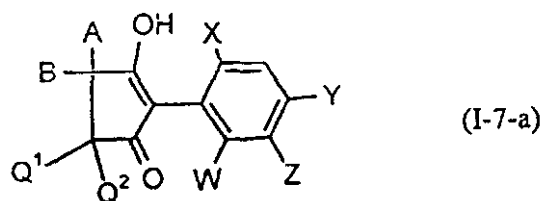
Hal、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下反应。

15

再者，还发现

(G) 式 (I-7-a) 化合物



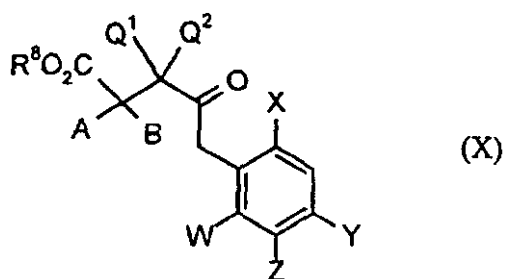
其中

20

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

如下获得：

使式 (X) 的酮羧酸酯



其中

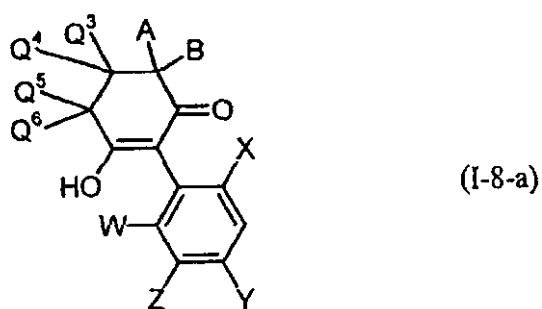
A、B、Q¹、Q²、W、X、Y和Z各如上定义，和

5 R⁸ 表示烷基(特别是C₁-C₈-烷基)

如果适宜在稀释剂存在下和在碱存在下，进行分子内环化。

此外，还发现，

(H) 式(I-8-a)化合物



10

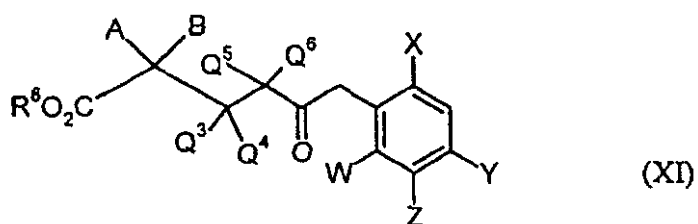
其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z如上定义，

如下获得：

使式(XI)的6-芳基-5-酮基-己酸酯

15



其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义，
和

R⁸ 表示烷基(优选 C₁-C₆-烷基)

在稀释剂存在下和在碱存在下进行分子内缩合；

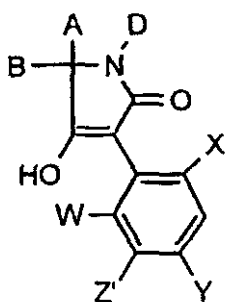
5 或

(I) 如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，其中A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y和Z各如上定义，如下获得

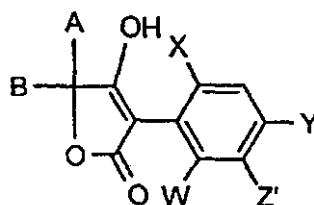
在溶剂、碱和催化剂存在下，适合的催化剂特别是钨配合物，使式(I-1'-a)至(I-8'-a)化合物

10

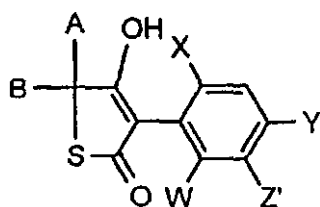
(I-1'-a):



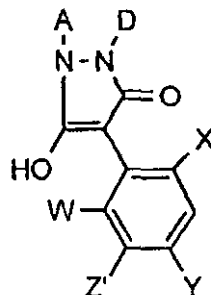
(I-2'-a):



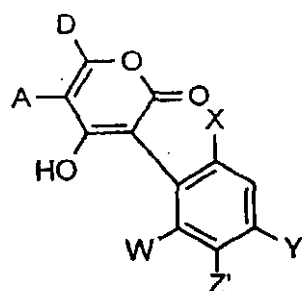
(I-3'-a):



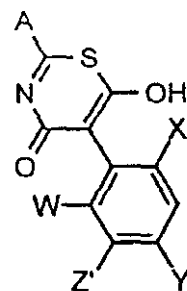
(I-4'-a):



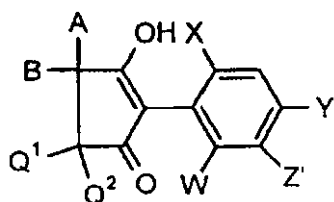
(I-5'-a):



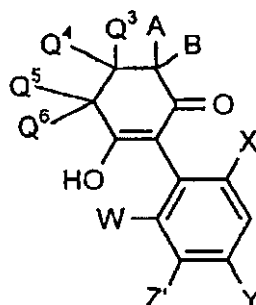
(I-6'-a):



(I-7'-a):



(I-8'-a):



其中

- A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X和Y各如上定义，和
 5 Z' 表示氯、溴或碘，优选表示溴，
 与式(XII)的硼酸反应



其中

- 10 Z 如上定义。
 还发现

(J) 如上所示的式(I-1-b)至(I-8-b)化合物，其中A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^1 、W、X、Y和Z各如上定义，如下获得

- 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下，使如上所示
 15 的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，其中A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义，在每一种情况下，
 (α)与式(XIII)的酰基卤反应



- 20 其中
 R^1 如上定义，和

Hal 表示卤素(特别是氯或溴),

或

(β)与式(XIV)羧酸酐反应



5

其中

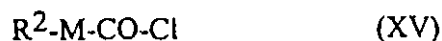
R^1 如上定义;

(K) 如上所示的式(I-1-c)至(I-8-c)化合物, 其中 A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^2 、M、W、X、Y和Z各如上定义且L表示氧, 如下获得

10

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物, 其中 A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义, 在每一种情况下, 与式(XV)的氯代甲酸酯或氯代甲酸硫酯反应

15



其中

R^2 和M 如上定义;

(L) 如上所示的式(I-1-c)至(I-8-c)化合物, 其中 A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^2 、M、W、X、Y和Z各如上定义且L表示硫, 如下获得

20

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物, 其中 A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义, 在每一种情况下,

25

与式(XVI)的氯代单硫代甲酸酯或氯代二硫代甲酸酯反应

30



其中

M 和 R² 如上定义;

- 5 (M) 如上所示的式 (I-1-d) 至 (I-8-d) 化合物, 其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、R³、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 如下获得

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使如上所示的式 (I-1-a) 至 (I-8-a) 化合物, 其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 在每一种情况下,

- 10 与式 (XVII) 的磺酰氯反应



其中

R³ 如上定义;

- 15 (N) 如上所示的式 (I-1-e) 至 (I-8-e) 化合物, 其中 A、B、D、L、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、R⁴、R⁵、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 如下获得
如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使如上所示的式 (I-1-a) 至 (I-8-a) 化合物, 其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 在每一种情况下,
- 20 与式 (XVIII) 的磷化合物反应



其中

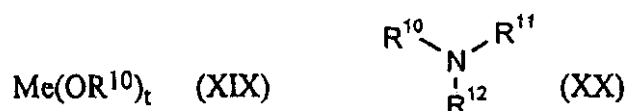
L、R⁴ 和 R⁵ 如上定义, 和

- 25 Hal 表示卤素 (特别氯或溴);

(O) 如上所示的式 (I-1-f) 至 (I-8-f) 化合物, 其中 A、B、D、E、

Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义，如下获得
如果适宜在稀释剂存在下，使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，其中A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义，在每一种情况下，

- 5 与式(XIX)或(XX)的金属化合物或胺反应

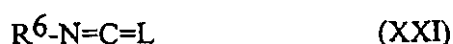


其中

- Me 表示单或二价金属(优选碱金属或碱土金属，如锂、钠、钾、
10 镁或钙)，t 表示数字1或2，和

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 相互独立地各表示氢或烷基(优选 C_1 - C_8 -烷基)，

- (P) 如上所示的式(I-1-g)至(I-8-g)化合物，其中A、B、D、L、
 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^6 、 R^7 、W、X、Y和Z各如上定义，如下获得
使如上所示的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，其中A、B、D、 Q^1 、
15 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、W、X、Y和Z各如上定义，在每一种情况下，
如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在催化剂存在下，
(α)与式(XXI)的异氰酸酯或异硫氰酸酯反应



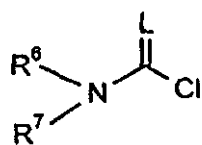
- 20 其中

R^6 和L各如上定义，

或

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下，

(β)与式(XXII)的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯反应



(XXII)

其中

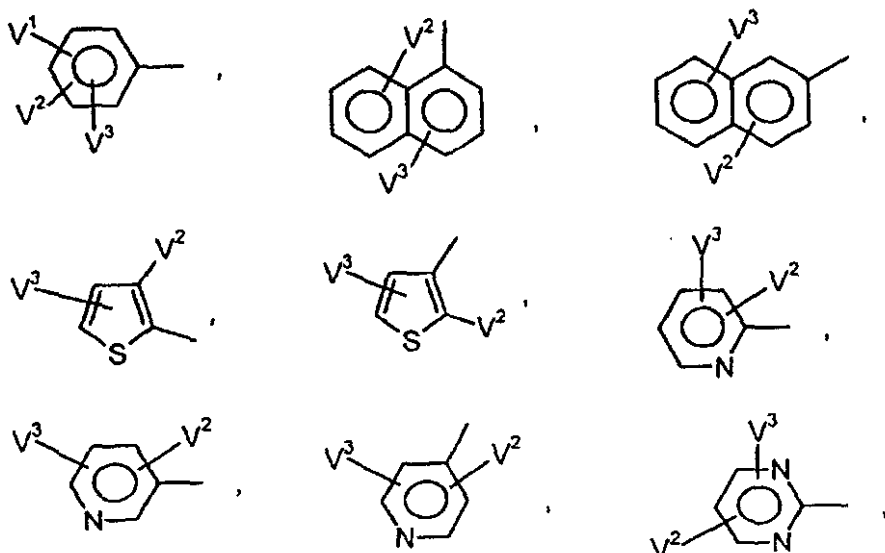
L、R⁶和R⁷ 如上定义。

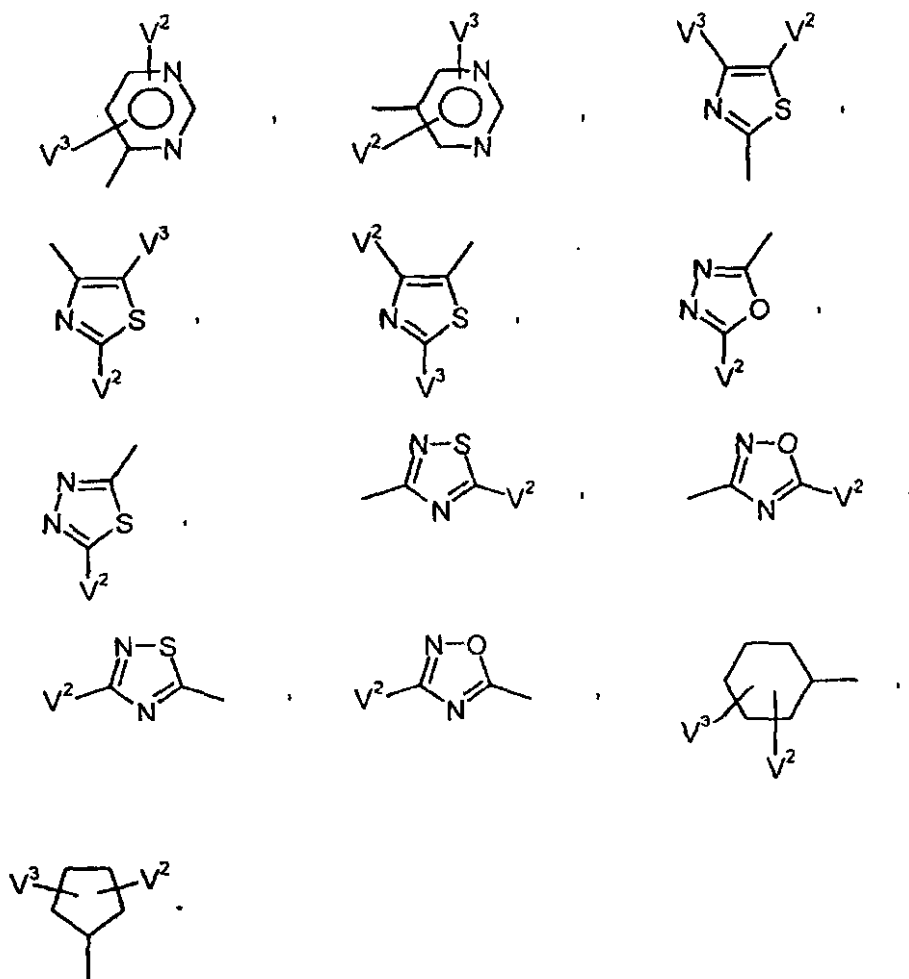
- 5 再者，业已发现，新的式(I)化合物作为农药具有非常好的活性，特别是作为杀虫剂、杀螨剂和作为除草剂。

式(I)提供本发明化合物的一般定义。在上下文中提到的各化学式中列出的基团的优选的取代基或范围说明如下：

- 10 X 优选表示卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₆-链烯氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₆-卤代链烯氧基、硝基、氰基或均任选由卤素-、C₁-C₆-烷基-、C₁-C₆-烷氧基-、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-、硝基-或氰基-取代的苯基、苯氧基、苯硫基、苄氧基或苄硫基。

- 15 Z 优选表示下列基团之一：





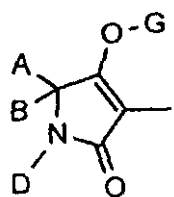
V^1 优选表示氢、卤素、 C_1-C_{12} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫

- 5 基、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基、氰基，或表示苯基、苯氧基、苯氧基- C_1-C_4 -烷基、苯基- C_1-C_4 -烷氧基、苯硫基- C_1-C_4 -烷基或苯基- C_1-C_4 -烷硫基，这些基团均任选由卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基或氰基单或多取代。

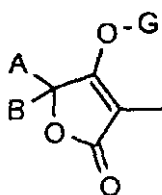
- 10 V^2 和 V^3 相互独立地各优选表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基。

W 和 Y 相互独立地各优选表示氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、硝基或氰基。

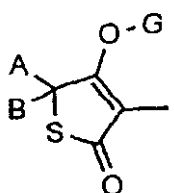
CKE 优选表示下列基团之一



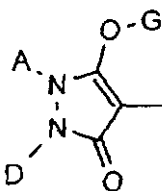
(1),



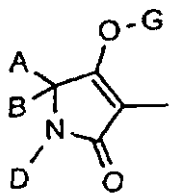
(2),



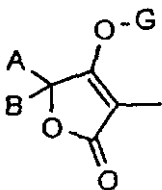
(3),



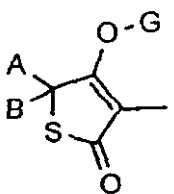
(4),



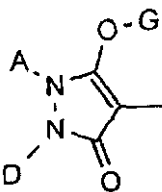
(1),



(2),



(3),



(4),

- A 优选表示氢或均任选由卤素取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其中任选地一或二个不直接相邻的环成员由氧和/或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基，或表示各任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的 C_6 -或 C_{10} -芳基(苯基或萘基)、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基、吡啶基、咪唑基、三唑基、吡唑基、嘧啶基、噻唑基或噻吩基)或 C_6 -或 C_{10} -芳基- C_1-C_6 -烷基(苯基- C_1-C_6 -烷基或萘基- C_1-C_6 -烷基)。

B 优选表示氢、 C_1-C_{12} -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基，或

- A、B 和其连接的碳原子优选表示饱和 C_3-C_{10} -环烷基或不饱和 C_5-C_{10} -环烷基，其中任选地一个环成员由氧或硫替代，且它们任选由

C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_{10} -环烷基、 C_1-C_8 -卤代烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷硫基、卤素或苯基单或二取代，或

- 5 A、B 和其连接的碳原子优选表示 C_3-C_6 -环烷基，该环烷基由一个任选地含有一或二个不直接相邻的氧和 / 或硫原子的亚烷基二基取代，或由亚烷二氧基或由亚烷二硫基取代，与其所连接的碳原子一起形成另一个五-至八元环，或

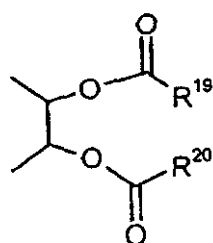
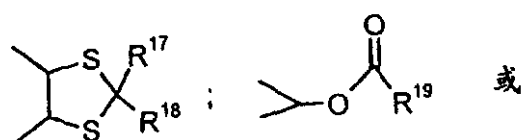
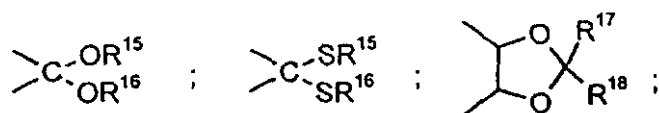
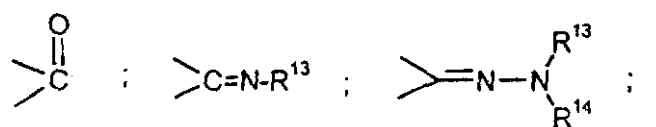
- 10 A、B 和其连接的碳原子优选表示 C_3-C_8 -环烷基或 C_5-C_8 -环烯基，其中二个取代基与它们连接的碳原子一起表示均任选由 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-或卤素-取代的 C_2-C_6 -烷二基、 C_2-C_6 -链烯二基或 C_4-C_6 -烷二烯二基，其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代。

- 15 D 优选表示氢，均任选由卤素-取代的 C_1-C_{12} -烷基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_3-C_8 -炔基、 C_1-C_{10} -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、 C_1-C_{10} -烷硫基- C_2-C_8 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷基-取代的其中任选地一个环成员由氧和 / 或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基，或表示各任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、氨基-或硝基-取代的苯基、具有 5 或 6 个环原子的杂芳基(例如呋喃基、咪唑基、吡啶基、噻唑基、吡唑基、嘧啶基、吡咯基、噻吩基或三唑基)、苯基- C_1-C_6 -烷基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳基- C_1-C_6 -烷基(例如呋喃基-、咪唑基-、吡啶基-、噻唑基-、吡唑基-、嘧啶基-、吡咯基-、噻吩基-或三唑基- C_1-C_6 -烷基)，或
- 20

A 和 D 一起优选表示均任选取代的 C_3-C_6 -烷二基或 C_3-C_6 -链烯二基，其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代，

其中，可能的取代基各为：

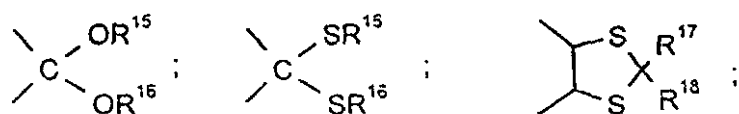
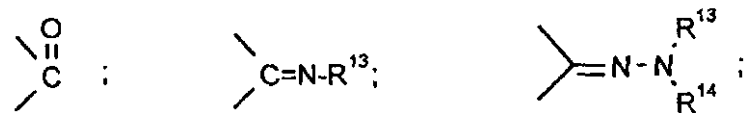
- 25 卤素、羟基、巯基或均任选由卤素-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_3-C_7 -环烷基、苯基或苄氧基，或另一 C_3-C_6 -烷二基、 C_3-C_6 -链烯二基或丁二烯基，这些基团任选由 C_1-C_6 -烷基取代或其中任选地二个相邻的取代基与其连接的碳原子一起形成另一具有 5 或 6 个环原子的饱和或不饱和环(在式(I-1)化合物的情况下，
- 30 A 和 D，与其连接的碳原子一起，表示，例如下文提到的基团 AD-1 至 AD-10)，该环可以含有氧或硫，或其中任选地含有下列基团之一：

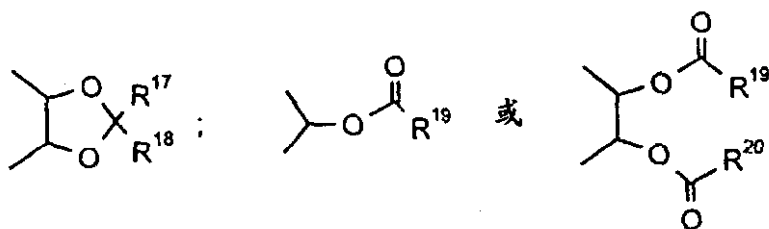


或

- A 和 Q' 一起优选表示 C₃-C₆-烷二基或 C₄-C₆-链烯二基，它们各任选由相同或不同的选自下列的基团单或二取代：卤素，羟基，C₁-C₁₀-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₃-C₇-环烷基，它们各任选由相同或不同的卤素单至三取代，和苄氧基或苯基，它们各任选由相同或不同的选自卤素、C₁-C₆-烷基或 C₁-C₆-烷氧基的基团单至三取代；且所述 C₃-C₆-烷二基或 C₄-C₆-链烯二基还任选含有下列基团之一：

10





或由一个 C_1-C_2 -烷二基或由氧原子桥接, 或

Q^1 优选表示氢或 C_1-C_4 -烷基。

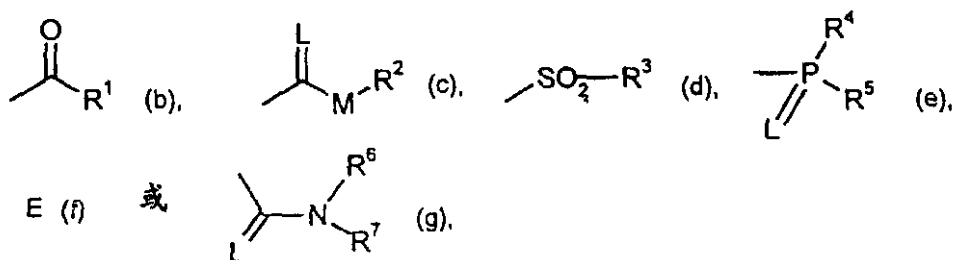
5 Q^2 、 Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地各优选表示氢或 C_1-C_4 -烷基。

Q^3 优选表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_6 -烷硫基- C_1-C_2 -烷基、任选由 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基或任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_2 -卤代烷基-、 C_1-C_2 -卤代烷氧基-、氨基-或硝基-取代的苯基, 或

Q^3 和 Q^4 与其连接的碳原子一起优选表示一个任选由 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_2 -卤代烷基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_7 -环。

G 优选表示氢(a)或表示下列基团之一:

15



特别是(a)、(b)或(c)

其中

E 表示金属离子或铵离子,

20 L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫。

R^1 优选表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_{20} -烷基、 C_2-C_{20} -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_8 -烷硫基- C_1-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -

烷氧基- C_1-C_8 -烷基、任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其中任选一或多个（优选不多于两个）不直接相邻的环成员由氧和/或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基，

- 5 表示任选由卤素-、氟基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、 C_1-C_6 -烷硫基-或 C_1-C_6 -烷基磺酰基-取代的苯基，

表示任选由卤素-、氟基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-或 C_1-C_6 -卤代烷氧基-取代的苯基- C_1-C_6 -烷基，

- 10 表示任选由卤素-或 C_1-C_6 -烷基-取代的 5 或 6 元的杂芳基（例如吡啶基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基），

表示任选由卤素-或 C_1-C_6 -烷基-取代的苯氧基- C_1-C_6 -烷基，或

表示任选由卤素-、氨基-或 C_1-C_6 -烷基取代的 5-或 6-元杂芳氧基- C_1-C_6 -烷基（例如，吡啶氧基- C_1-C_6 -烷基、嘧啶氧基- C_1-C_6 -烷基或噻唑氧基- C_1-C_6 -烷基）。

- 15 R^2 优选表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_{20} -烷基、 C_2-C_{20} -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基、多- C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_8 -烷基，

表示任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的 C_3-C_8 -环烷基，或

- 20 表示均可任选由卤素-、氟基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-或 C_1-C_6 -卤代烷氧基-取代的苯基或苄基。

R^3 优选表示任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基，或表示均可任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基。

- 25 R^4 和 R^5 相互独立地各优选表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_1-C_8 -烷基氨基、二- $(C_1-C_8$ -烷基)氨基、 C_1-C_8 -烷硫基、 C_2-C_8 -链烯硫基、 C_3-C_7 -环烷基硫基，或表示均可任选由卤素-、氟基-、硝基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、 C_1-C_4 -烷硫基-、 C_1-C_4 -卤代烷硫基-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -卤代烷基-取代的苯基、苯氧基或苯硫基。

- 30 R^6 和 R^7 相互独立地各优选表示氢，表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_3-C_8 -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基，表示任选由卤素-、 C_1-C_8 -卤代烷基-、 C_1-C_8 -烷基-或

C_1-C_8 -烷氧基-取代的苯基, 任选由卤素-、 C_1-C_8 -烷基-、 C_1-C_8 -卤代烷基-或 C_1-C_8 -烷氧基-取代的苄基或一起表示一个任选由 C_1-C_4 -烷基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_6 -亚烷基。

- 5 R^{13} 优选表示氢, 表示均可任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_8 -烷氧基, 表示任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_8 -环烷基, 或表示均可任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氟基-取代的苯基、苯基- C_1-C_4 -烷基或苯基- C_1-C_4 -烷氧基。

- 10 R^{14} 优选表示氢或 C_1-C_8 -烷基或

R^{13} 和 R^{14} 一起优选表示 C_4-C_6 -烷二基。

R^{15} 和 R^{16} 相同或不同且优选表示 C_1-C_6 -烷基, 或

- 15 R^{15} 和 R^{16} 一起优选表示 C_2-C_4 -烷二基, 它任选由 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基或由任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氟基-取代的苯基取代。

R^{17} 和 R^{18} 相互独立地优选表示氢, 表示任选由卤素-取代的 C_1-C_8 -烷基, 或表示任选由卤素-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、硝基-或氟基-取代的苯基, 或

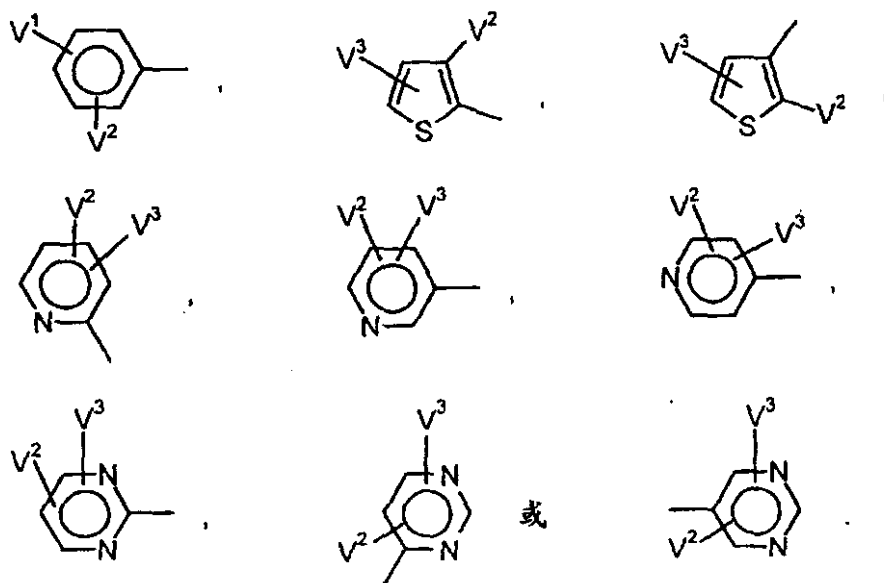
- 20 R^{17} 和 R^{18} 与其连接的碳原子一起优选表示一个羰基, 或表示任选由卤素-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_5-C_7 -环烷基。

R^{19} 和 R^{20} 相互独立地各优选表示 C_1-C_{10} -烷基、 C_2-C_{10} -链烯基、 C_1-C_{10} -烷氧基、 C_1-C_{10} -烷基氨基、 C_3-C_{10} -链烯氨基、二- $(C_1-C_{10}$ -烷基)氨基或二- $(C_3-C_{10}$ -链烯基)氨基。

- 25 在优选的定义中, 卤素表示氟、氯、溴和碘, 且特别是表示氟、氯和溴。

X 特别优选表示氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_4 -链烯氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_4 -卤代链烯氧基、硝基或氟基。

- 30 Z 特别优选表示下列基团之一:

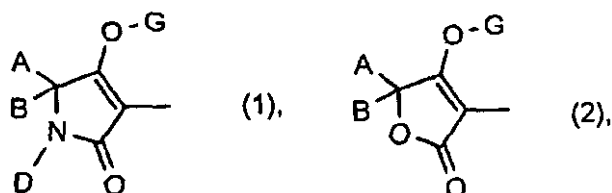


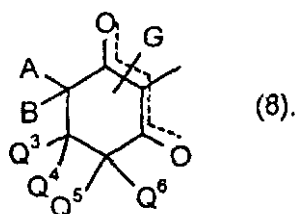
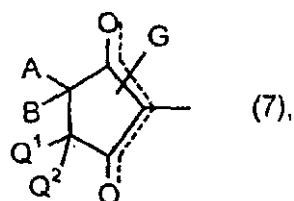
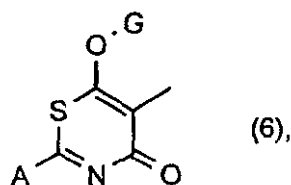
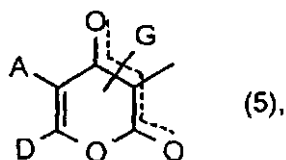
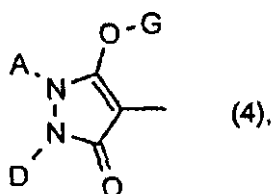
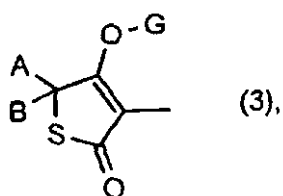
- 5 V^1 特别优选表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基、氰基，或表示苯基、苯氧基、苯氧基- C_1-C_2 -烷基、苯基- C_1-C_2 -烷氧基、苯硫基- C_1-C_2 -烷基或苯基- C_1-C_2 -烷硫基，这些基团各任选由氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -卤代烷氧基、硝基或氰基单或二取代。

V^2 和 V^3 相互独立地各特别优选表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_2 -卤代烷基或 C_1-C_2 -卤代烷氧基。

- 10 W 和 Y 相互独立地各特别优选表示氢、氟、氯、溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基。

CKE 特别优选表示下列基团之一：





- 5 A 特别优选表示氢，或表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基或(但不在式(I-5)、(I-7)和(I-8)的情况下)均可任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷氧基-取代的苯基、呋喃基、吡啶基、咪唑基、三唑基、吡唑基、噻啶基、噻唑基、噻吩基或苯基- C_1-C_4 -烷基。

- 10 B 特别优选表示氢或 C_1-C_6 -烷基，或

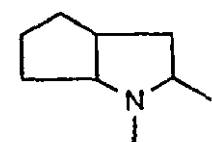
A、B 和其连接的碳原子特别优选表示饱和或不饱和的 C_5-C_7 -环烷基，其中任选地一个环成员由氧或硫替代且其任选由 C_1-C_6 -烷基、 C_5-C_6 -环烷基、 C_1-C_3 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、氟、氯或苯基单取代，或

- 15 A、B 和其连接的碳原子特别优选表示 C_5-C_6 -环烷基，它由一个任选地含有一或二个不直接相邻的氧或硫原子的亚烷基二基或由亚烷二氧基或由亚烷二硫基取代的，这些基团与其连接的碳原子一起形成另一个五或六个环，或

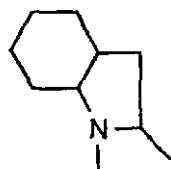
A、B 和其连接的碳原子特别优选表示 C_3-C_6 -环烷基或 C_5-C_6 -环烯基，其中二个取代基与其连接的碳原子一起表示均可任选由 C_1-C_5 -烷基-、 C_1-C_5 -烷氧基-、氟-、氯-或溴-取代的 C_2-C_4 -烷二基或 C_2-C_4 -链烯二基，其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代，或表示丁二烯二基。

- 5 D 特别优选表示氢，或表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{10} -烷基、 C_3-C_6 -链烯基、 C_1-C_8 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基或 C_1-C_8 -烷硫基- C_2-C_6 -烷基，表示任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_2 -卤代烷基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基或(但不在式(I-1)和(I-4)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-或 C_1-C_4 -卤代烷氧基-取代的苯基、呋喃基、咪唑基、吡啶基、噻唑基、吡唑基、嘧啶基、吡咯基、噻吩基、三唑基或苯基- C_1-C_4 -烷基，或
- 10 A 和 D 一起特别优选表示任选取代的 C_3-C_5 -烷二基，其中一个亚甲基可以由一个羰基、氧或硫替代，可能的取代基为羟基、 C_1-C_6 -烷基或 C_1-C_4 -烷氧基，或

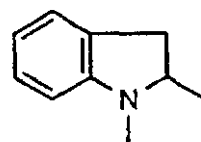
A 和 D(在式(I-1)的情况下)与其连接的原子一起特别优选表示基团 AD-1 至 AD-10 之一:



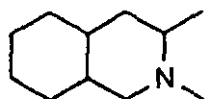
AD-1



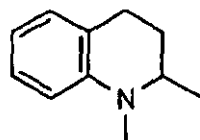
AD-2



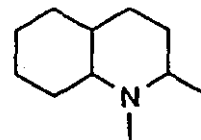
AD-3



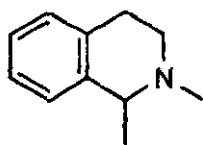
AD-4



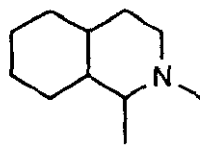
AD-5



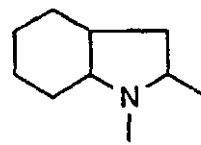
AD-6



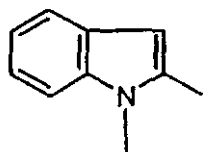
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

或者

- A 和 Q' 一起特别优选表示 C₃-C₄-烷二基或 C₃-C₄-链烯二基, 它们
 5 各任选由相同或不同的选自下列的基团单或二取代: 氟、氯、羟基和
 各任选由氟单至三取代的 C₁-C₈-烷基和 C₁-C₄-烷氧基, 或

Q¹ 特别优选表示氢。

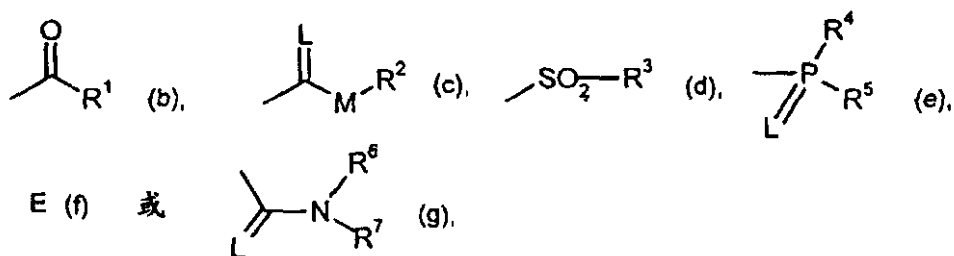
Q² 特别优选表示氢。

Q⁴、Q⁵ 和 Q⁶ 相互独立地各特别优选表示氢或 C₁-C₃-烷基。

- 10 Q³ 特别优选表示氢、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₂-烷基、
 C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₂-烷基或任选由甲基-或甲氧基-取代的、其中任选
 地一个亚甲基由氧或硫替代的 C₃-C₆-环烷基, 或

- Q³ 和 Q⁴ 与其连接的碳原子一起特别优选表示一个任选由 C₁-C₄-烷
 基-或 C₁-C₄-烷氧基-取代的饱和的其中任选地一个环成员由氧或硫替
 15 代的 C₅-C₆-环。

G 特别优选表示氢(a)或特别优选表示下列基团之一:



特别是表示(a)、(b)或(c),

其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫, 和

5 M 表示氧或硫.

R^1 特别优选表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷硫基- C_1-C_6 -烷基、多- C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基或任选由氟-、氯-、 C_1-C_5 -烷基或 C_1-C_6 -烷氧基-取代的其中任选地一或二个不直接相连的环成员由氧和/或硫替代的 C_3-C_7 -环烷基,

表示任选由氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-、 C_1-C_3 -卤代烷氧基-、 C_1-C_4 -烷硫基-或 C_1-C_4 -烷基磺酰基-取代的苯基,

15 表示任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-或 C_1-C_3 -卤代烷氧基-取代的苯基- C_1-C_4 -烷基,

表示均可任选由氟-、氯-、溴-或 C_1-C_4 -烷基-取代的吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、呋喃基或噻吩基,

表示任选由氟-、氯-、溴-或 C_1-C_4 -取代的苯氧基- C_1-C_3 -烷基, 或

20 表示均可任选由氟-、氯-、溴-、氨基-或 C_1-C_4 -烷基-取代的吡啶氧基- C_1-C_3 -烷基、嘧啶氧基- C_1-C_3 -烷基或噻唑氧基- C_1-C_3 -烷基.

R^2 特别优选表示均可任选由氟-取代的 C_1-C_{16} -烷基、 C_2-C_{16} -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基或多- C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_6 -烷基,

25 表示任选由氟-、氯-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的 C_3-C_7 -环烷基, 或

表示均可任选由氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_3 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-或 C_1-C_3 -卤代烷氧基-取代的苯基或苄基.

30 R^3 特别优选表示任选由氟-取代的 C_1-C_6 -烷基, 或特别优选表示均可任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-、 C_1-C_3 -卤代烷氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基.

R^4 和 R^5 相互独立地各特别优选表示 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基,

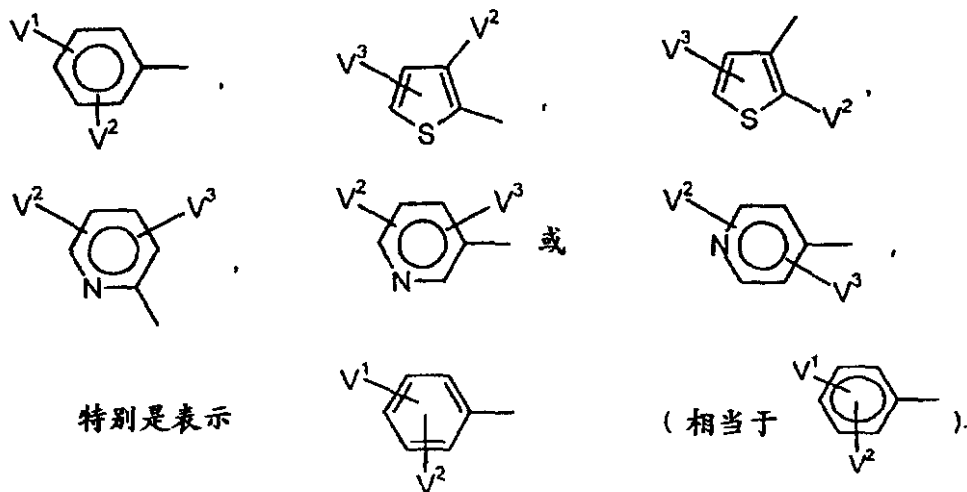
5 C_1-C_6 -烷基氨基、二- $(C_1-C_6$ -烷基)氨基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_3-C_4 -链烯硫基、 C_3-C_6 -环烷基硫基，或表示均可任选由氟-、氯-、溴-、硝基-、氰基-、 C_1-C_3 -烷氧基-、 C_1-C_3 -卤代烷氧基-、 C_1-C_3 -烷硫基-、 C_1-C_3 -卤代烷硫基-、 C_1-C_3 -烷基-或 C_1-C_3 -卤代烷基-取代的苯基、苯氧基或苯硫基。

10 R^6 和 R^7 相互独立地各特别优选表示氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_6 -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基，表示任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_3 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的苯基，表示任选由氟-、氯-、溴-、 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_3 -卤代烷基-或 C_1-C_4 -烷氧基-取代的苄基，或一起表示一个任选由甲基-或乙基-取代的其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_4-C_5 -亚烷基。

在特别优选的基团定义中，卤素表示氟、氯、溴和碘，特别是表示氟、氯和溴。

15 X 非常特别优选表示氟、氯、甲基、乙基、丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、硝基或氰基。

Z 非常特别优选表示下列基团之一：

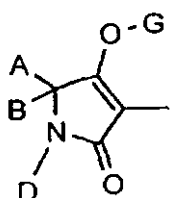


20 V^1 非常特别优选表示氢、氟、氯、溴、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、三氟甲基、三氟甲氧基、硝基、氰基或任选由氟、氯、甲基、甲氧基、三氟甲基或三氟甲氧基单取代的苯基。

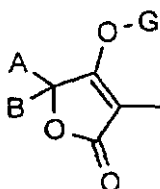
V^2 和 V^3 相互独立地各非常特别优选表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲基或三氟甲氧基。

W 和 Y 相互独立地各非常特别优选表示氢、氟、氯、甲基、乙基、正丙基、甲氧基、乙氧基或丙氧基。

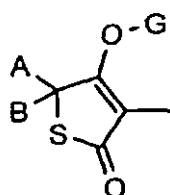
5 CKE 非常特别优选表示下列基团之一：



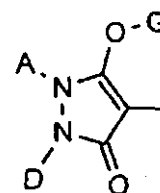
(1),



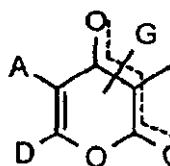
(2),



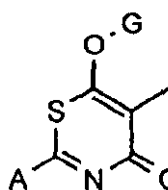
(3),



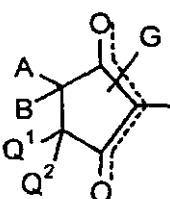
(4),



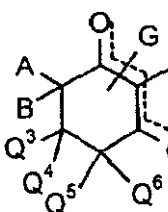
(5),



(6),



(7),



(8),

10 A 非常特别优选表示氢，或表示各任选由氟-取代的 C_1-C_8 -烷基或 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、任选由氟-、甲基-、乙基-或甲氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基或(但不在式(I-5)、(I-7)和(I-8)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、氨基-或硝基-取代的苯基或苄基。

B 非常特别优选表示氢或 C_1-C_4 -烷基, 或

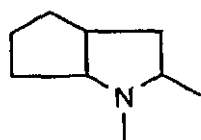
- A、B 与其连接的碳原子一起非常特别优选表示饱和的 C_5-C_6 -环烷基, 其中任选地一个环成员由氧或硫替代且其任选由甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、氟或氯取代, 或

- A、B 与其连接的碳原子一起非常特别优选表示 C_5-C_6 -环烷基或 C_5-C_6 -环烯基, 其中二个取代基与其连接的碳原子一起表示其中各任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_2-C_4 -烷二基或 C_2-C_4 -链烯二基, 或表示丁二烯二基。

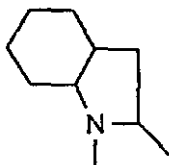
- D 非常特别优选表示氢, 表示均可任选由氟-或氯-取代的 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_4 -链烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_2-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_2-C_4 -烷基或其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_3-C_6 -环烷基或(但不在式(I-1)和(I-4)化合物的情况下)表示均可任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基或苄基, 或

- A 和 D 一起非常特别优选表示任选取代的 C_3-C_4 -烷二基, 其中任选地一个碳原子由硫替代且它任选由羟基、甲基、乙基、甲氧基或乙氧基取代, 或

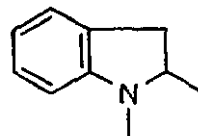
A 和 D(在式(I-1)化合物的情况下)与其连接的原子一起表示下列基团 AD 之一:



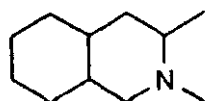
AD-1



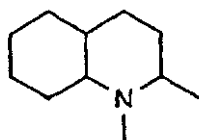
AD-2



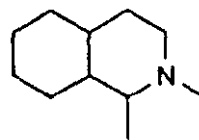
AD-3



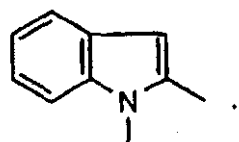
AD-4



AD-6



AD-8



AD-10

A 和 Q^1 非常特别优选表示任选由氟、羟基、甲基或甲氧基单-或二
5 取代的 C_3 - C_4 -烷二基或丁烯二基, 或

Q^1 非常特别优选表示氢。

Q^2 非常特别优选表示氢。

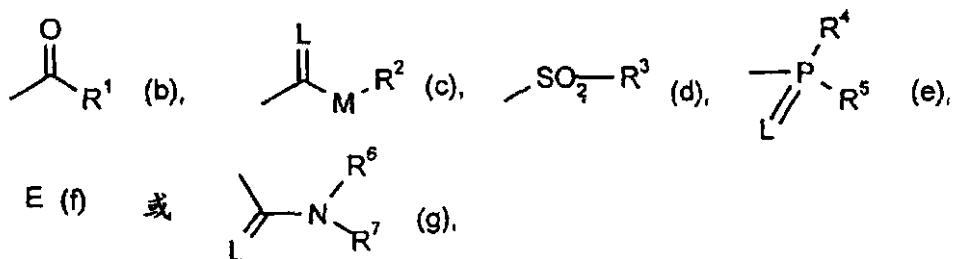
Q^4 、 Q^5 和 Q^6 相互独立地非常特别优选表示氢、甲基或乙基。

Q^3 非常特别优选表示氢、甲基、乙基或其中任选地一个亚甲基
10 由氧或硫替代的 C_3 - C_6 -环烷基, 或

Q^3 和 Q^4 与其连接的碳原子一起非常特别优选表示一个任选地由甲
基-或甲氧基-取代的其中任选地一个环成员由氧或硫替代的饱和的
 C_5 - C_6 -环。

G 非常特别优选表示氢 (a) 或表示下列基团之一:

15



特别是 (a)、(b) 或 (c),

其中

E 表示金属离子或铵离子,

L 表示氧或硫, 和

M 表示氧或硫.

- R¹ 非常特别优选表示均可任选由氟-或氯-取代的 C₁-C₁₄-烷基、C₂-C₁₄-链烯基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₆-烷基、
 5 多-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基或任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、丙基-、异丙基-、丁基-、异丁基-、叔丁基-、甲氧基-、乙氧基-、正丙氧基-或异丙氧基-取代的 C₃-C₆-环烷基, 该环烷基中任选地一或二个不直接相邻的环成员由氧和 / 或硫替代,

- 表示任选氟-、氯-、溴-、氟基-、硝基-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、甲硫基-、乙硫基-、甲基磺酰基-或乙基磺酰基-取代的苯基,
 10

表示任选氟-、氯-、溴-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苄基,

- 表示均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-或乙基-取代的呋喃基、噻吩基、吡啶基、嘧啶基、噻唑基或吡唑基,
 15

表示任选由氟-、氯-、甲基-或乙基-取代的苯氧基-C₁-C₂-烷基, 或

表示均可任选由氟-、氯-、氟基-、甲基-或乙基-取代的吡啶氧基-C₁-C₂-烷基、嘧啶氧基-C₁-C₂-烷基或噻唑氧基-C₁-C₂-烷基.

- R² 非常特别优选表示均可任选由氟-取代的 C₁-C₁₄-烷基、C₂-C₁₄-链烯基、C₁-C₄-烷氧基-C₂-C₆-烷基或多-C₁-C₄-烷氧基-C₂-C₆-烷基,
 20

表示任选由氟-、氯-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-或甲氧基-取代的 C₃-C₆-环烷基,

- 或表示均可任选由氟-、氯-、氟基-、硝基-、甲基-、乙基-、正丙基-、异丙基-、甲氧基-、乙氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代的苯基或苄基.
 25

R³ 非常特别优选表示均可任选由氟-取代的甲基、乙基、正丙基、异丙基或均可任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、叔丁基-、甲氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、氟基-或硝基-取代的苯基或苄基.

- R⁴ 和 R⁵ 相互独立地各非常特别优选表示 C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₁-C₄-烷硫基, 或表示均可任选由氟-、氯-、溴-、硝基-、氟基-、C₁-C₂-烷氧基-、C₁-C₂-
 30

氟代烷氧基-、 C_1-C_2 -烷硫基-、 C_1-C_2 -氟代烷硫基-或 C_1-C_3 -烷基-取代的苯基、苯氧基或苯硫基。

- 5 R^6 和 R^7 相互独立地各非常特别优选表示氢，表示 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_4 -链烯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，表示任选由氟-、氯-、溴-、三氟甲基-、甲基-或甲氧基-取代的苯基，表示任选由氟-、氯-、溴-、甲基-、三氟甲基-或甲氧基-取代的苄基，或一起表示其中任选地一个亚甲基由氧或硫替代的 C_5-C_6 -亚烷基。

- 10 上面提到的一般或优选的基团定义或说明可以按需要相互组合，即，包括各自范围和优选范围间的组合。它们适合于终产物且因此适合于前体或中间体。

本发明优选的是含有上文列出的优选含意组合的式(I)化合物。

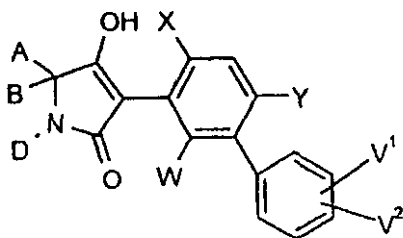
本发明特别优选的是含有上文列出的特别优选含意组合的式(I)化合物。

- 15 本发明非常特别优选的是含有上文列出的非常特别优选含意组合的式(I)化合物。

饱和或不饱和烃基如烷基或链烯基，在每一种情况下，也包括与杂原子的组合，例如烷氧基中，均可以是其可能的直链或支链。

- 20 除非另有说明，任选取代的基团可以是单或多取代，且在多取代的情况下，取代基可以相同或不同。

除了制备实施例中的化合物外，可以特别提到下列式(I-1-a)化合物



00.11.24

表 1: $W = H$; $X = CH_3$; $Y = H$, $V^1 = H$, $V^2 = H$.

A	B	D
CH_3	H	H
C_2H_5	H	H
C_3H_7	H	H
i- C_3H_7	H	H
C_4H_9	H	H
i- C_4H_9	H	H
s- C_4H_9	H	H
t- C_4H_9	H	H
CH_3	CH_3	H
C_2H_5	CH_3	H
C_3H_7	CH_3	H
i- C_3H_7	CH_3	H

表1 (续):


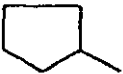
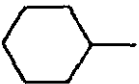
A	B	D
C_4H_9	CH_3	H
i- C_4H_9	CH_3	H
s- C_4H_9	CH_3	H
t- C_4H_9	CH_3	H
C_2H_5	C_2H_5	H
C_3H_7	C_3H_7	H
	CH_3	H
	CH_3	H
	CH_3	H
$-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-(CH_2)_5-$		H
$-(CH_2)_6-$		H
$-(CH_2)_7-$		H
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H

表1 (续):

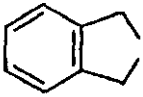
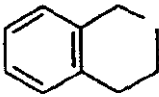
A	B	D
	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	H
	$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$	H
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-(CH_2)_2-CH- \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \end{array}$	H
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

表1 (续):


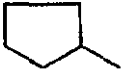
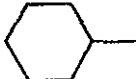

A	D	B
	$-(CH_2)_3-$	H
	$-(CH_2)_4-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-CH_2-$	H
	$-CH_2-CH_2-CHCH_3-$	H
	$-CH_2-CHCH_3-CHCH_3-$	H
	$-CH_2-S-CH_2-$	H
	$-CH_2-S-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-S-CH_2-$	H
	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---(CH}_2\text{)}_3\text{---} \end{array}$	H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	$i\text{-}C_3H_7$	H
H		H
H		H
H		H
CH_3	CH_3	H
CH_3	C_2H_5	H
CH_3	C_3H_7	H
CH_3	$i\text{-}C_3H_7$	H
CH_3		H

表 1 (续):

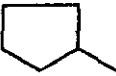
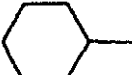
A	D	B
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

表 2: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

5 W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

表 3: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

表 4: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 4-Cl; V² = H.

10 表 5: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.

表 6: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 4-Cl; V² = H.

表 7: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

15 W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 3-Cl; V² = H.

表 8: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 3-Cl; V² = H.

表 9: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 3-Cl; V² = H.

20 表 10: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 2-Cl; V² = 4-Cl.

表 11: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = 2-Cl; V² = 4-Cl.

表 12: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

$W = CH_3$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 2-Cl$; $V^2 = 4-Cl$.

表 13: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

$W = H$; $X = CH_3$; $Y = H$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.

5 表 14: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

$W = H$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.

表 15: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

$W = CH_3$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.

表 16: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

10 $W = H$; $X = CH_3$; $Y = H$; $V^1 = 4-CH_3$; $V^2 = H$.

表 17: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

$W = H$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 4-CH_3$; $V^2 = H$.

表 18: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

$W = CH_3$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 4-CH_3$; $V^2 = H$.

15 表 19: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

$W = H$; $X = CH_3$; $Y = H$; $V^1 = 4-OCH_3$; $V^2 = H$.

表 20: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

$W = H$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 4-OCH_3$; $V^2 = H$.

表 21: A、B 和 D 各如表 1 中所给出

20 $W = CH_3$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 4-OCH_3$; $V^2 = H$.

除了制备实施例中的化合物外, 可以特别提到下列式 (I-2-a) 化合物

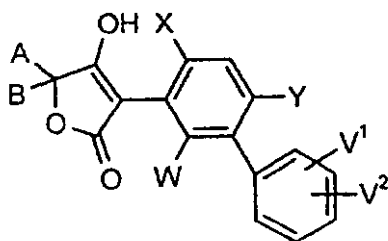


表 22: $W = H$; $X = CH_3$, $Y = H$, $V^1 = H$, $V^2 = H$.

A	B
CH_3	H
C_2H_5	H
C_3H_7	H
i- C_3H_7	H
C_4H_9	H
i- C_4H_9	H
s- C_4H_9	H
t- C_4H_9	H

表 22 (续) :


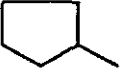
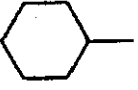
A	B
CH_3	CH_3
C_2H_5	CH_3
C_3H_7	CH_3
i- C_3H_7	CH_3
C_4H_9	CH_3
i- C_4H_9	CH_3
s- C_4H_9	CH_3
t- C_4H_9	CH_3
C_2H_5	C_2H_5
C_3H_7	C_3H_7
	CH_3
	CH_3
	CH_3
-(CH_2) ₂ -	
-(CH_2) ₄ -	
-(CH_2) ₅ -	
-(CH_2) ₆ -	
-(CH_2) ₇ -	
-(CH_2) ₂ -O-(CH_2) ₂ -	
- CH_2 -O-(CH_2) ₃ -	
-(CH_2) ₂ -S-(CH_2) ₂ -	
- CH_2 -CHCH ₃ -(CH_2) ₃ -	
-(CH_2) ₂ -CHCH ₃ -(CH_2) ₂ -	

表 22 (续):

A	B
$(\text{CH}_2)_2\text{-CHC}_2\text{H}_5\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHC}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHi-C}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHOC}_2\text{H}_5\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHOC}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\text{-(CH}_2)_2\text{-CHi-C}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\text{-(CH}_2)_2\text{-C(CH}_3)_2\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\text{-CH}_2\text{-(CHCH}_3)_2\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	
$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---(CH}_2)_2\text{---CH---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---CH}_2\text{---} \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---CH}_2\text{---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---(CH}_2)_4\text{---} \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---(CH}_2)_2\text{---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---(CH}_2)_3\text{---} \end{array}$	

表 23: A 和 B 各如表 22 所给出

5 W = H; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

表 24: A 和 B 各如表 22 所给出

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH₃; V¹ = H; V² = H.

表 25: A 和 B 各如表 22 所给出

W = H; X = CH₃; Y = H; V¹ = 4-Cl; V² = H.

表 26: A 和 B 各如表 22 所给出

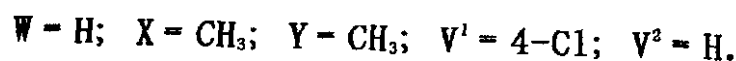
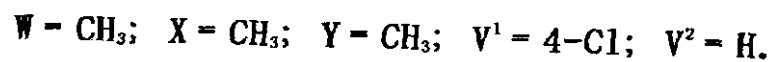


表 27: A 和 B 各如表 22 所给出



5 表 28: A 和 B 各如表 22 所给出

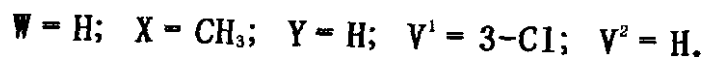


表 29: A 和 B 各如表 22 所给出

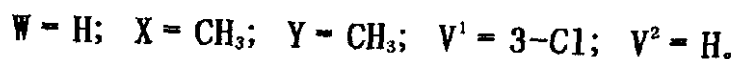


表 30: A 和 B 各如表 22 所给出

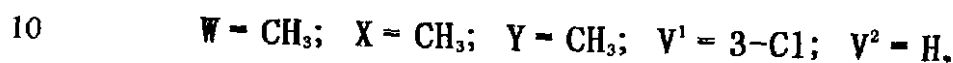


表 31: A 和 B 各如表 22 所给出

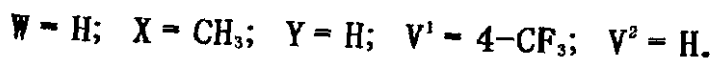
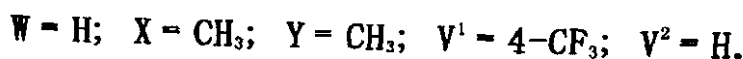


表 32: A 和 B 各如表 22 所给出



15 表 33: A 和 B 各如表 22 所给出

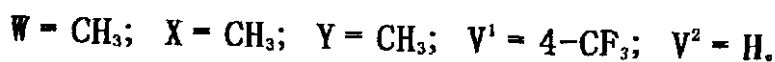


表 34: A 和 B 各如表 22 所给出

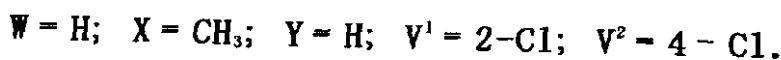


表 35: A 和 B 各如表 22 所给出

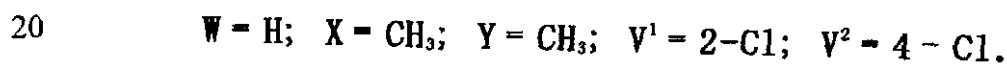


表 36: A 和 B 各如表 22 所给出

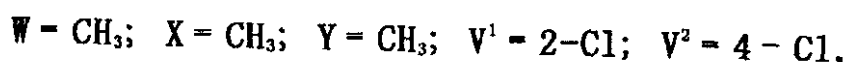
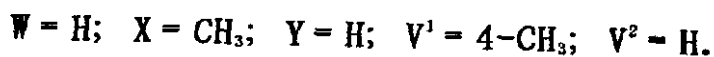


表 37: A 和 B 各如表 22 所给出



25 表 38: A 和 B 各如表 22 所给出

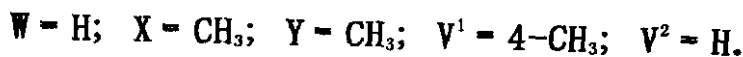


表 39: A 和 B 各如表 22 所给出

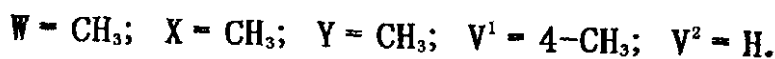


表 40: A 和 B 各如表 22 所给出

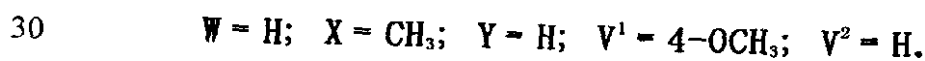


表 41: A 和 B 各如表 22 所给出

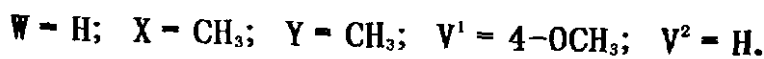
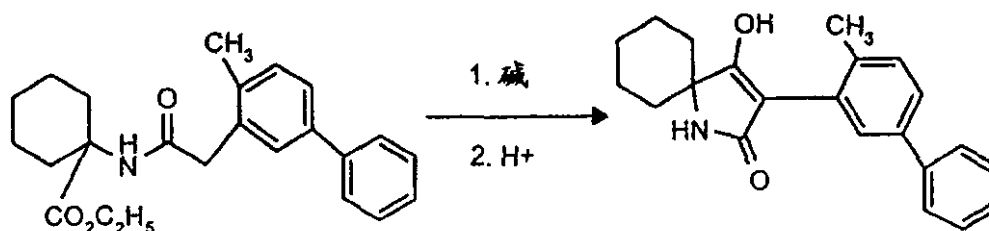


表 42: A 和 B 各如表 22 所给出

$W = CH_3$; $X = CH_3$; $Y = CH_3$; $V^1 = 4-OCH_3$; $V^2 = H$.

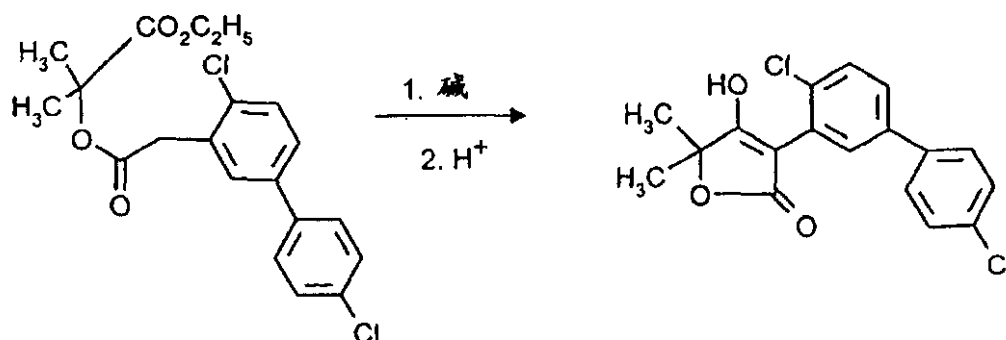
根据方法 (A), 使用例如 N-[(6-甲基-3-苯基)-苯基乙酰基]-1-氨基-环己基-羧酸乙酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以由下列

5 反应式来表示:



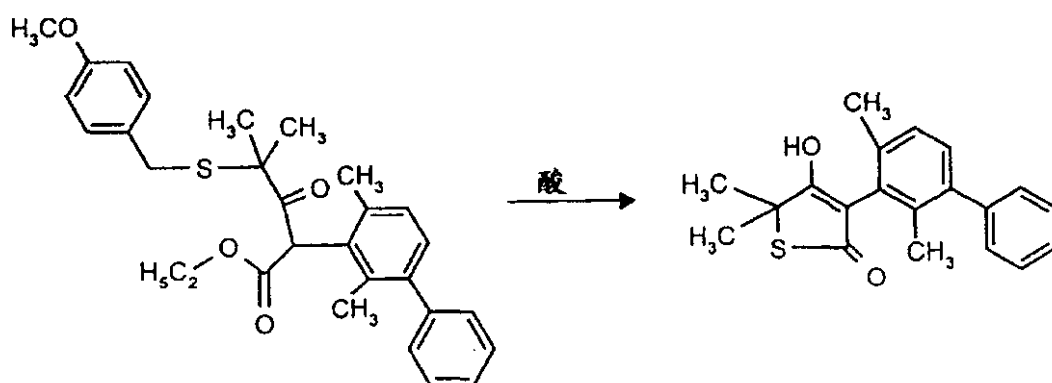
根据方法 (B), 使用例如 O-[(2-氯-5-(4-氯)-苯基)-苯基乙酰基]-2-羟基异丁酸乙酯 (B), 本发明方法之途径可以用下列反应式表

10 示:

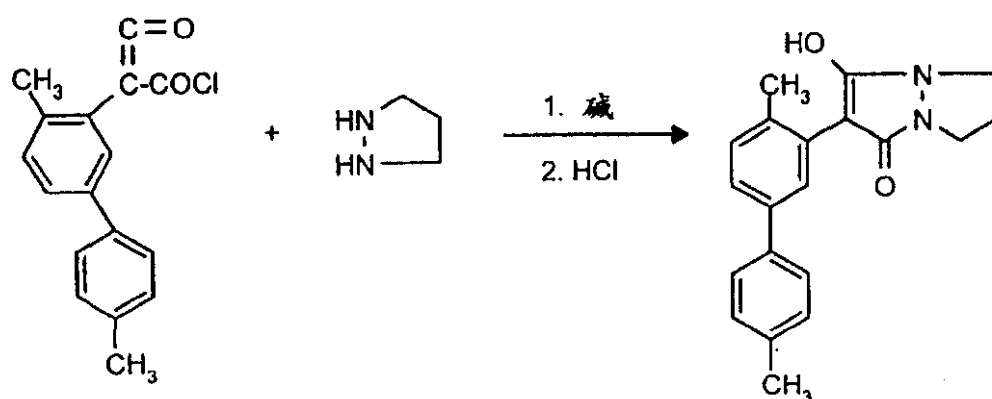


根据方法 (C), 使用例如 2-[(2,6-二甲基-3-苯基)-苯基]-4-(4-甲氧基)-苯基硫基-4-甲基-3-氧代-戊酸乙酯, 本发明方法之途径可

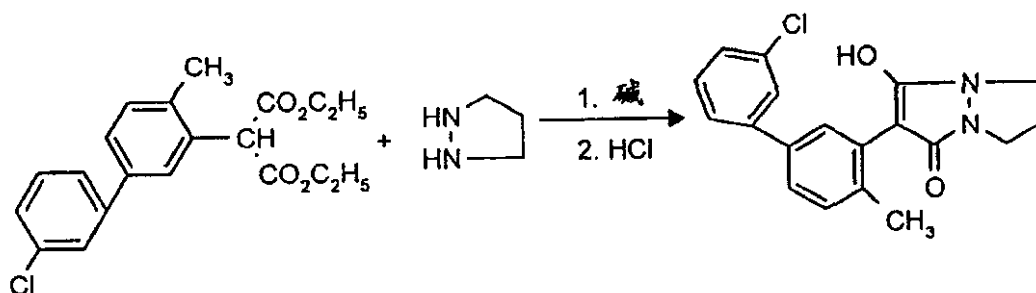
15 以用下列反应式表示:



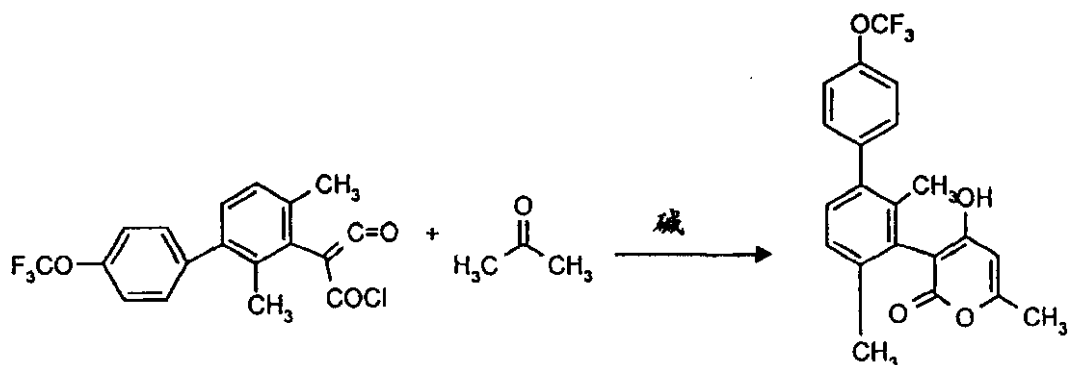
根据方法(D-α), 使用例如氯羧基 3-[6-甲基-3-(4-甲基)-苯基)-苯基]烯酮和 1,2-二氮杂环戊烷作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



根据方法(D-β), 使用例如 3-[6-甲基-3-(3-氯-苯基)]-苯基丙二酸二乙酯和 1,2-二氮杂环戊烷作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:

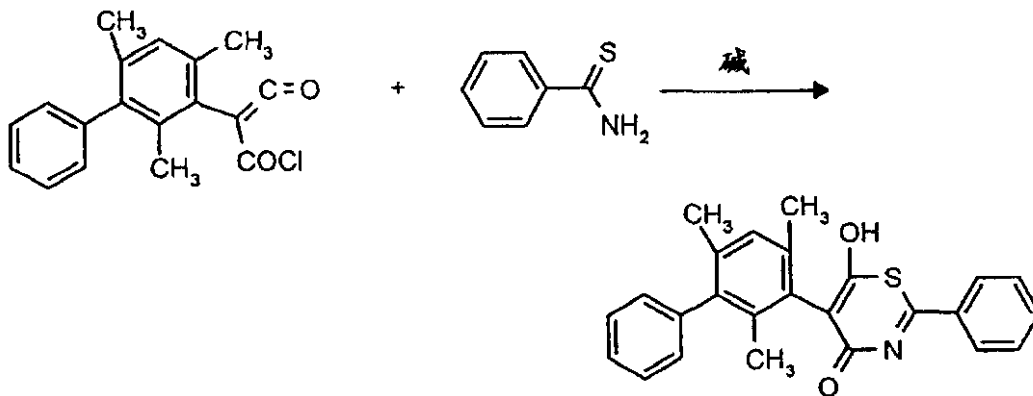


根据方法(E), 使用例如 2-[(2,6-二甲基-3-(4-三氟甲氧基-苯基))-苯基]烯酮和丙酮作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



5

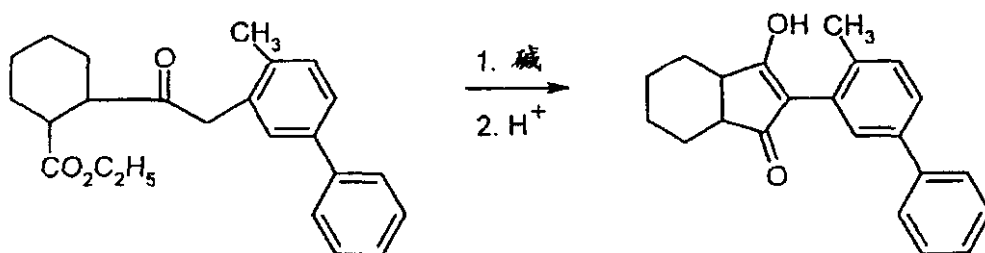
根据方法(F), 使用例如氯羰基 2-[(2,4,6-三甲基-3-苯基)-苯基]-烯酮和硫代苯甲酰胺作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



10

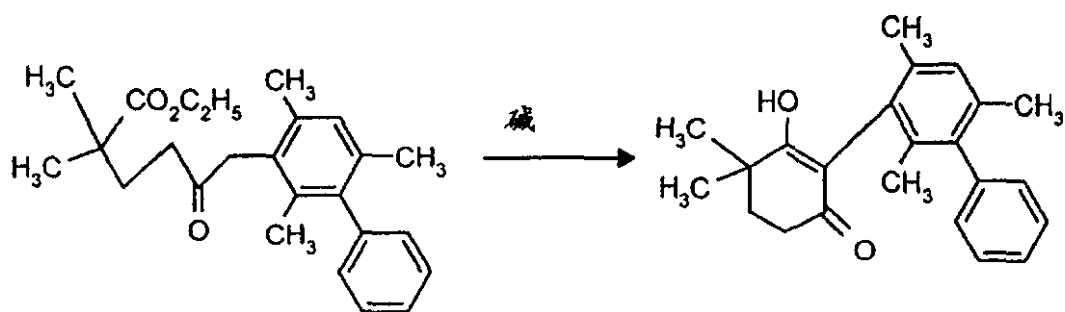
根据方法(G), 使用 5-[(6-甲基-3-苯基)-苯基]-2,3-四亚甲基-4-氧代-戊酸乙酯, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:

15



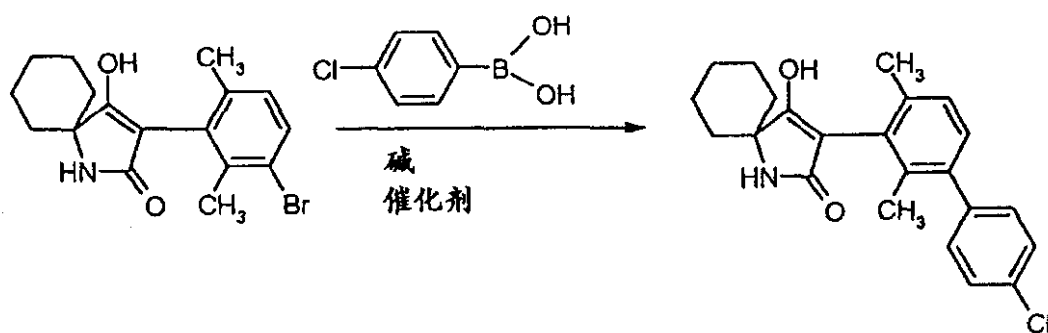
根据方法(H)，使用 5-[(2,4,6-三甲基-3-苯基)-苯基]-2,2-二甲基-5-氧代-己酸乙酯，本发明方法之途径可以用下列反应式表示：

5



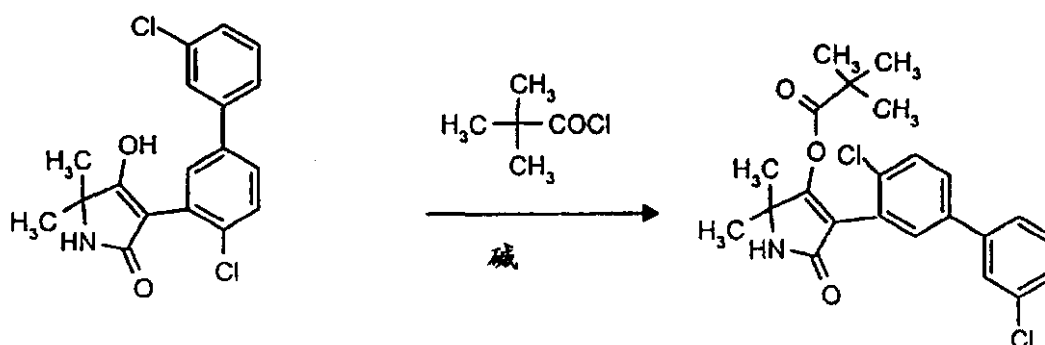
根据方法(I)，使用 3-[(2,6-二甲基-3-溴)-苯基]-4,4-(五亚甲基)-吡咯烷-2,4-二酮和 4-氯苯基硼酸作为起始原料，本发明方法之途径可以用下列反应式表示：

10

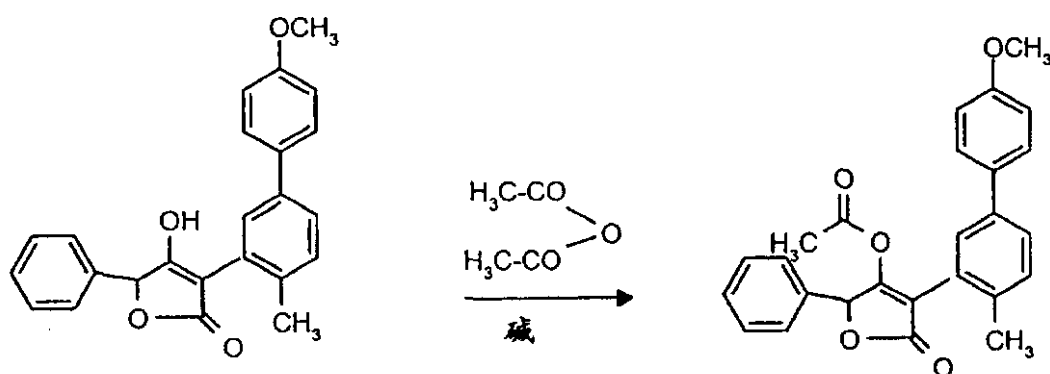


根据方法(J α)，使用 3-[(2-氯-5-(3-氯-苯基))-苯基]-5,5-二甲基吡咯烷-2,4-二酮和新戊酰氯作为起始原料，本发明方法之途径可以用下列反应式表示：

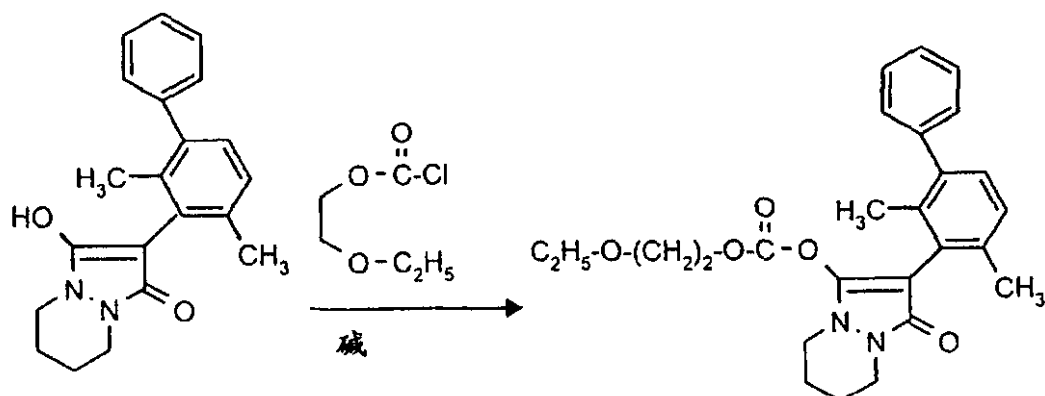
15



- 根据方法(J), (方案β), 使用 3-[(6-甲基-3-(4-甲氧基-苯基))-苯基]-4-羟基-5-苯基-Δ³-二氢吡喃-2-酮和乙酸酐作为起始原料,
- 5 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:

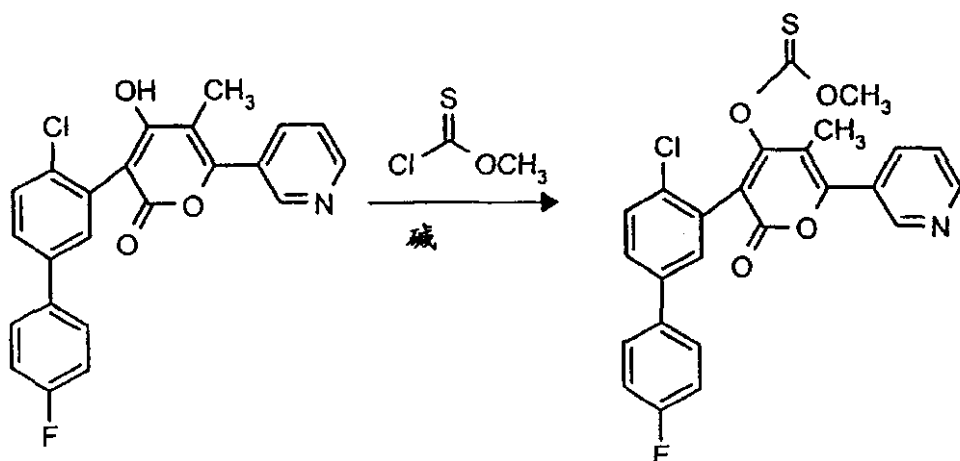


- 根据方法(K), 使用 8-[(2,6-二甲基-3-苯基)-苯基]-1,6-二氮杂-双环-(4.3.0^{1,6})-壬烷-7,9-二酮和氯甲酸乙氧基乙基酯作为起始原料,
- 10 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



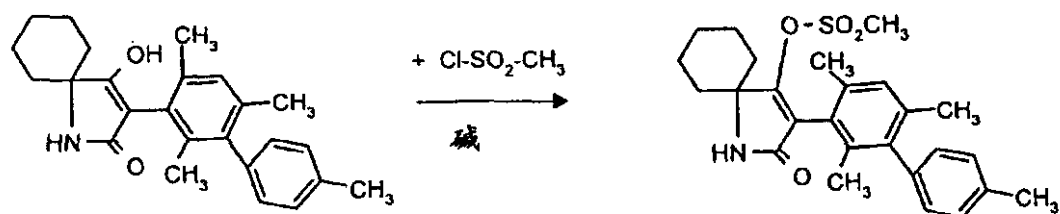
根据方法(L), 使用 3-[(2-氯-5-(4-氯-苯基)-苯基]-4-羟基-5-甲基-6-(3-吡啶基)-吡喃酮和氯单硫代甲酸甲酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:

5

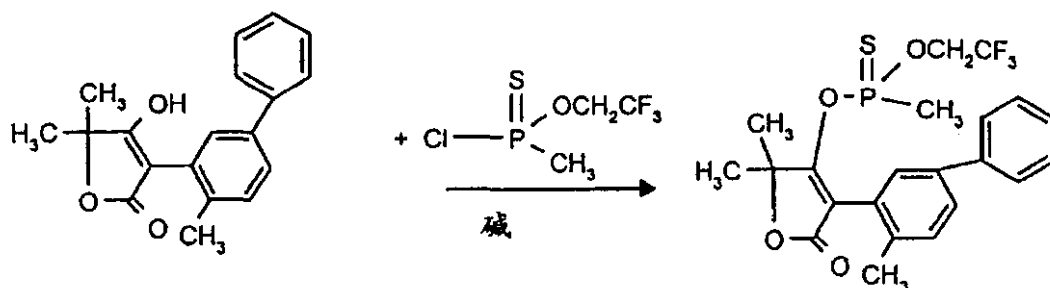


根据方法(M), 使用 2-[(2,4,6-三甲基-3-(4-甲基-苯基))-苯基]-5,5-五亚甲基-吡咯烷-2,4-二酮和甲磺酰氯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:

10

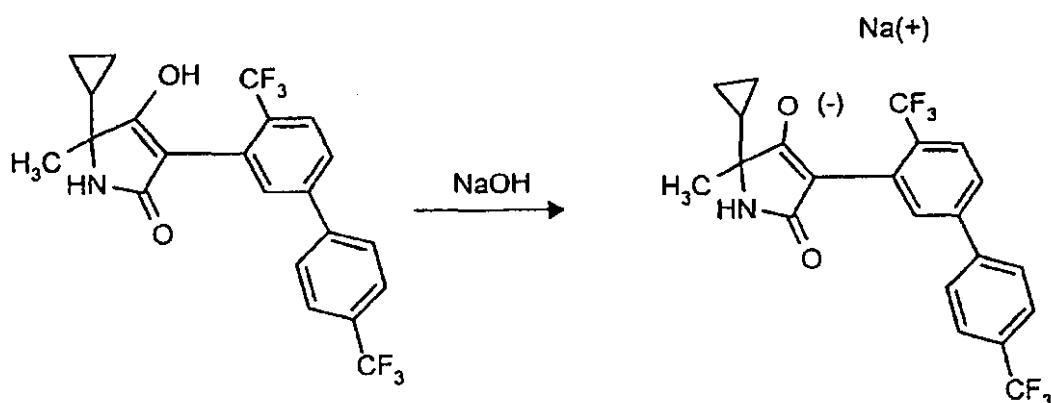


根据方法(N), 使用 2-[(6-甲基-3-苯基)-苯基]-4-羟基-5,5-二甲基- Δ^3 -二氢呋喃-2-酮和甲硫代磷酸氯 2,2,2-三氟乙基酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



5

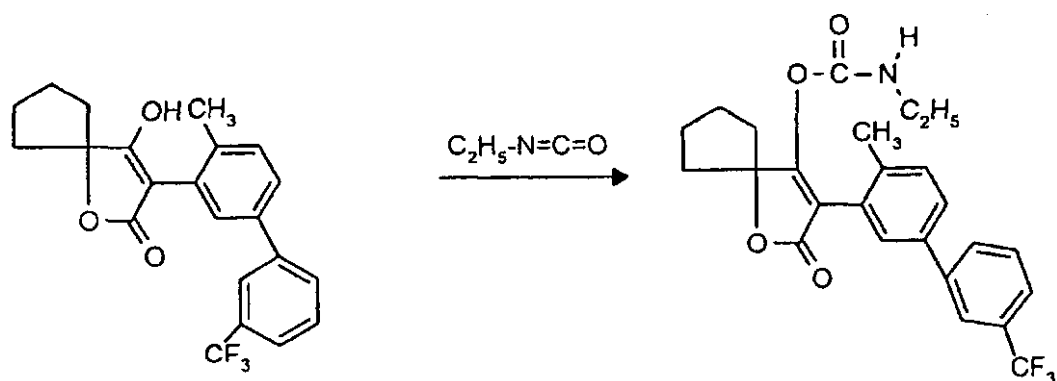
根据方法(O), 使用 3-[(2-三氟甲基-5-(4-三氟甲基-苯基))-苯基]-5-环丙基-5-甲基-吡咯烷-2,4-二酮和氢氧化钠作为组分, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



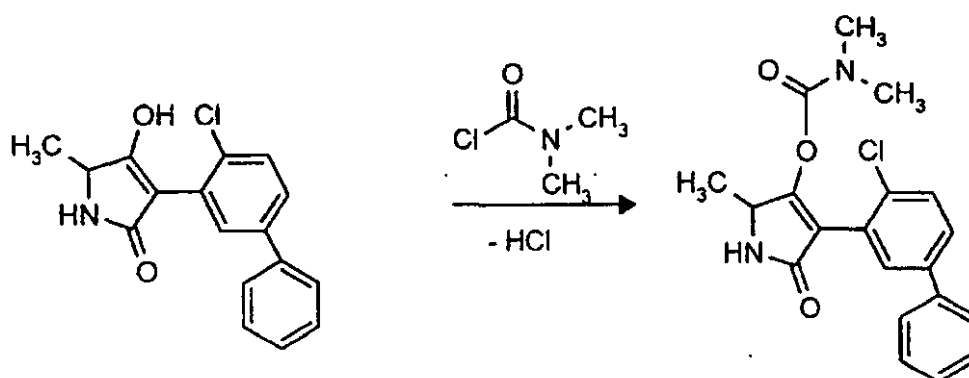
10

根据方法(P)(方案α), 使用 3-[(6-甲基-6-(3-三氟甲基-苯基))-苯基]-4-羟基-5-四亚甲基- Δ^3 -二氢呋喃-2-酮和异氰酸乙酯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:

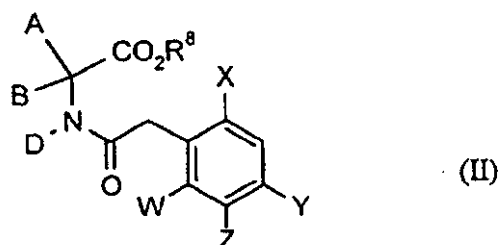
15



根据方法(P)(方案β)使用3-[(2-氯-5-苯基)-苯基]-5-甲基-吡咯烷-2,4-二酮和二甲基氨基甲酰氯作为起始原料, 本发明方法之途径可以用下列反应式表示:



需在本发明方法(a)中作为起始原料的式(II)化合物是新的



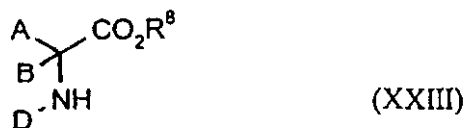
10

其中

A、B、D、W、X、Y、Z和R⁸各如上定义。

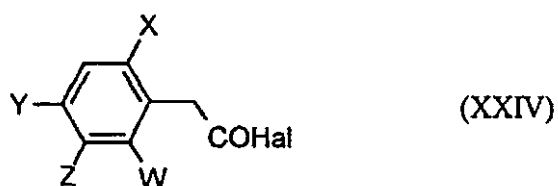
式(II)的酰基氨基酸酯如下获得, 例如, 将式(XXIII)的氨基酸

衍生物



其中

- 5 A、B、R⁸和D各如上定义，
用式(XXIV)的取代的苯基乙酰氯酰化



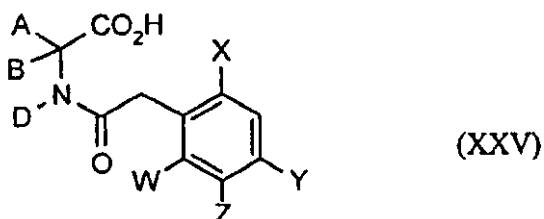
其中

- 10 W、X、Y和Z各如上定义，和
Hal 表示氯或溴

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

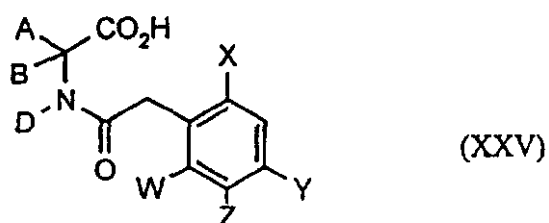
或

- 15 将式(XXV)的酰基氨基酸进行酯化 (Chem. Ind. (伦敦) 1568(1968)),



其中

- 20 A、B、D、W、X、Y和Z各如上所定义。
式(XXV)化合物是新的



其中

A、B、D、W、X、Y 和 Z 如上定义。

- 5 式 (XXV) 化合物如下获得，
将式 (XXVI) 的氨基酸



其中

- 10 A、B 和 D 如上定义
用式 (XXIV) 的取代的苯基乙酰氯酰化，



其中

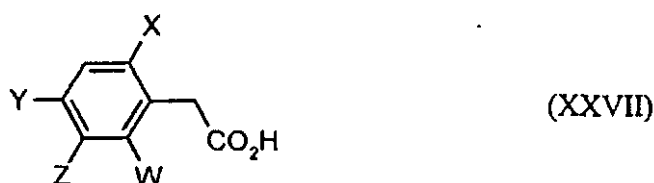
- 15 W、X、Y 和 Z 各如上定义，和
Hal 表示氯或溴，

例如根据 Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, 柏林 1977, p. 505).

- 20 式 (XXIV) 化合物是新的。它们可以根据原则上已知的方法制备
(参见，例如，H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Vol. 8, p. 467-469 (1952)).

式 (XXIV) 化合物如下获得，例如，如果适宜在稀释剂存在下 (例

如任选氯化的脂族或芳族烃如甲苯或二氯甲烷), 在 -20°C 至 150°C , 优选 -10°C 至 100°C 的温度下, 使式(XXVII)的取代的苯基乙酸



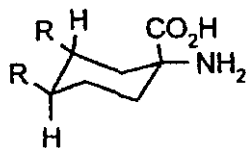
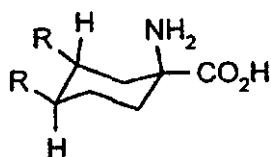
5 其中

W、X、Y和Z各如上定义,

与卤化剂(例如, 亚硫酸氯、亚硫酸溴、草酰氯、光气、三氯化磷、三溴化磷或五氯化磷)反应,

某些式(XXIII)和(XXVI)化合物是已知的, 和/或它们可以通过
10 已知的方法制备(参见, 例如, Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14]5, p. 11-22, 23-27(1970)).

其中 A 和 B 形成环的式(XXVIa)的取代的环状羧酸通过
Bucherer-Bergs 合成或通过 Strecker 合成常规地获得, 且在每一种
15 情况下, 获得不同的异构体形式. 因此, 在 Bucherer-Bergs 合成的
条件下, 主要获得其中基团 R 与羧基平伏的异构体(为简明起见下文
称作 β), 而在 Strecker 合成条件下, 主要获得其中基团 R 与氨基基
团平伏的异构体(为简明起见下文称作 α).

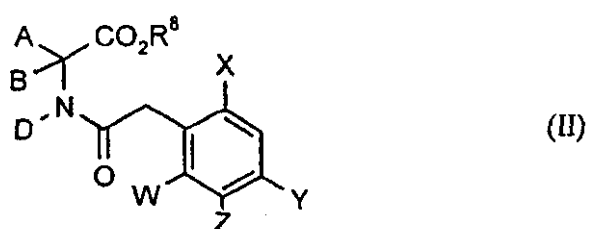


20 Bucherer-Bergs 合成
(β 异构体)

Strecker 合成
(α 异构体)

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

再者, 使用于上述方法(A)中的式(II)起始原料



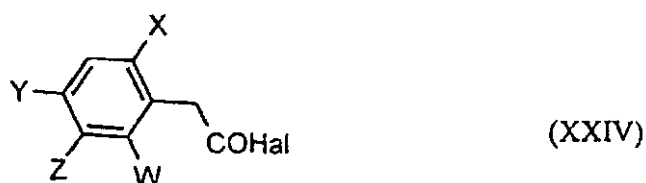
其中

- A、B、D、W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，
 5 可以如下制备，
 使式 (XXVIII) 的氨基腈



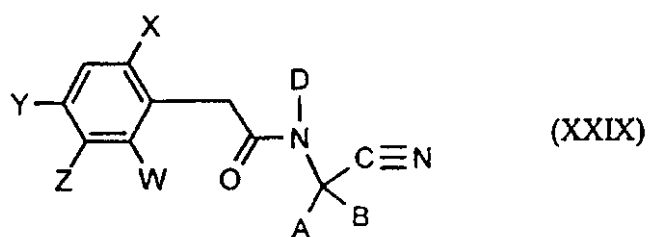
其中

- 10 A、B 和 D 各如上定义，
 与式 (XXIV) 的取代的苯基乙酰卤反应



其中

- 15 W、X、Y、Z 和 Hal 各如上定义，
 给出式 (XXIX) 化合物



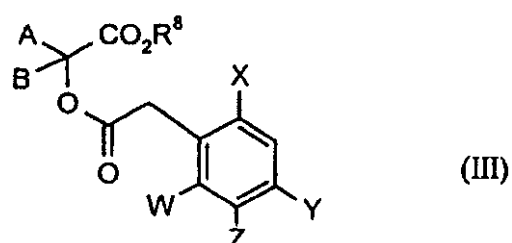
其中

A、B、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义，

且它随后进行酸性醇解。

5 式 (XXIX) 化合物同样是新的。

需在本发明方法 (B) 中作为起始原料的式 (III) 化合物是新的



其中

10 A、B、W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义。

它们可以用原则上已知的方法制备。

因此，式 (III) 化合物例如如下获得，将式 (XXX) 的 2-羟基羧酸酯



15 其中

A、B 和 R^8 各如上定义，

用式 (XXIV) 的取代的苯基乙酰卤酰化



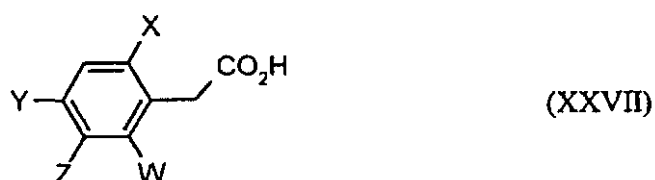
其中

W、X、Y、Z 和 Hal 各如上定义

5 (Chem. Reviews 52, 237-416(1953)和先前提到的应用例).

再者, 式(III)化合物如下获得

将式(XXVII)的取代的苯基乙酸



10 其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义

用式(XXXI)的 α -卤代羧酸酯烷基化



15 其中

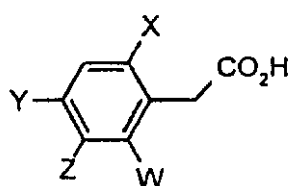
A、B 和 R^8 各如上定义, 和

Hal 表示氯或溴.

式(XXVII)化合物是新的.

式(XXXI)化合物是商业可得的.

20 式(XXVII)化合物



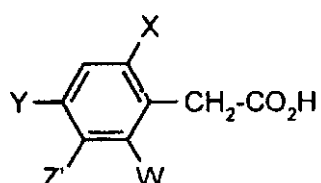
(XXVII)

其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义，

5 如下获得，例如

α) 在溶剂、碱和催化剂(优选钌配合物，如四(三苯基膦)钌)存在下，使式(XXVII-a)化合物



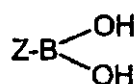
(XXVII-a)

10 其中

X 和 Y 各如上定义，

Z' 表示氯或溴，优选表示溴，

与式(XII)的硼酸反应



(XII)

15

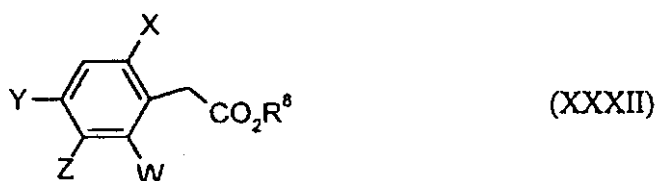
其中

Z 如上定义

或

β) 在通常已知的标准条件下，在酸或碱存在下，在溶剂存在下，将

20 式(XXXII)的苯基乙酸酯进行水解

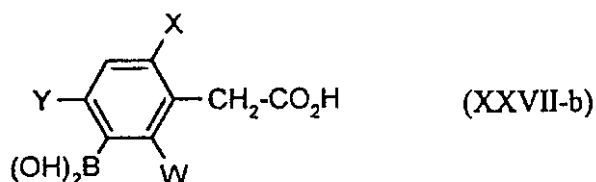


其中

W、X、Y、Z 和 R^6 各如上定义，

5 或

γ) 在溶剂、碱和催化剂(优选上面提到的钌配合物之一)存在下，使式 (XXVII-b) 的苯基乙酸



10 其中

W、X 和 Z 各如上定义，

与式 (XXXIII) 的卤素化合物反应



15 其中

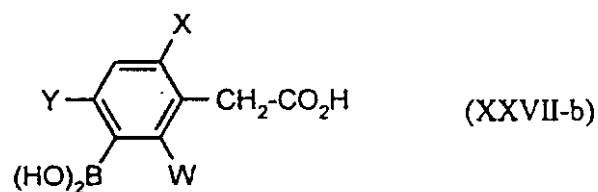
Z 如上定义，和

Hal 表示氯、溴或碘，优选溴和碘。

某些式 (XII) 和 (XXXIII) 化合物是已知的，它们中的一些可以商业获得，或它们可以通过原则上已知的方法制备。某些式 (XXVII-a) 的苯基乙酸由 WO 97/01535、WO 97/36 868 和 WO 98/05 638 已知，或它们可以通过其中描述的方法制备。

式 (XXVII-b) 和 (XXXII) 化合物是新的。

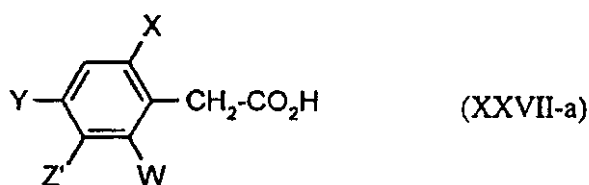
式 (XXVII-b) 化合物



其中

W、X 和 Y 各如上定义，

- 5 如下获得，例如，在稀释剂存在下，使式 (XXVII-a) 的苯基乙酸



其中

W、X、Y 和 Z' 各如上定义

- 10 与式 (XXXIV) 的锂化合物



其中

R^{21} 表示 C_1 - C_8 -烷基或苯基，优选表示正- C_4H_9 ，

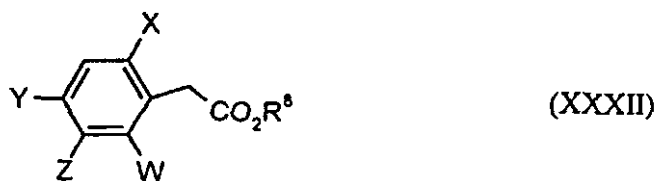
- 15 和式 (XXXV) 的硼酸酯反应



其中

R^8 如上定义。

- 20 式 (XXXIV) 和 (XXXV) 化合物商业可得的化合物。
式 (XXXII) 化合物



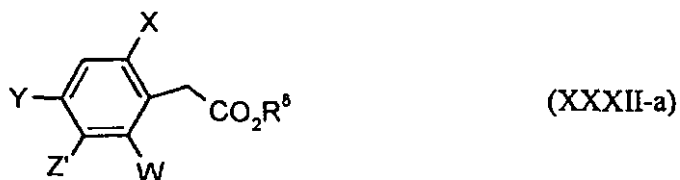
其中

W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义，

5 如下获得，例如，

在溶剂、碱和催化剂(优选上面提到的钨配合物之一)存在下，

使式 (XXXII-a) 苯基乙酸酯



10 其中

R^8 、W、X、Y 和 Z' 各如上定义，

与式 (XII) 的硼酸反应

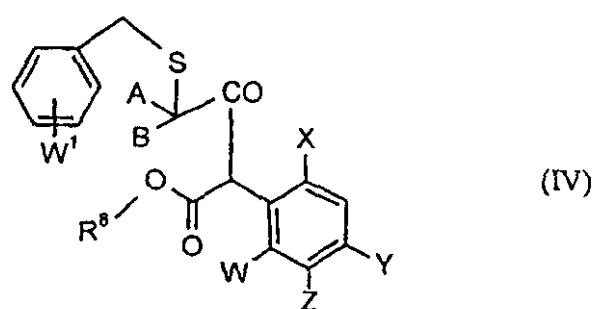


15 其中

Z 如上定义。

一些式 (XXXII-a) 的苯基乙酸酯由 WO 97 / 01535、WO 97 / 36868 和 WO 98 / 0563 已知，或它们可以通过其中描述的方法制备。

需在方法 (C) 中作为起始原料的式 (IV) 化合物是新的

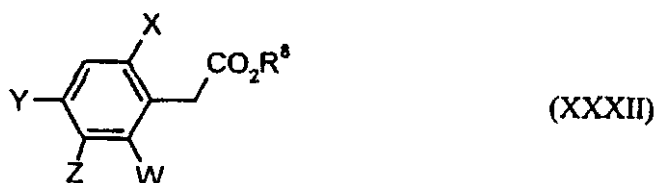


其中

A、B、W、W¹、X、Y、Z 和 R⁸ 各如上定义。

5 它们通过原则上已知的方法制备。

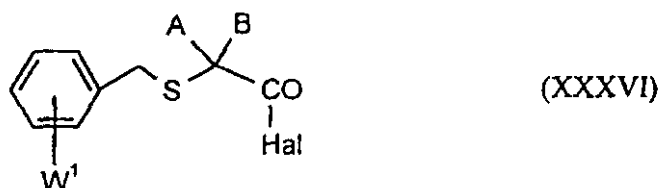
式 (IV) 化合物如下获得，例如，在强碱存在下，将式 (XXXII) 的取代的苯基乙酸酯



10 其中

W、X、Y、R⁸ 和 Z 各如上定义，

用式 (XXXVI) 的 2-苄硫基-酰基卤酰化



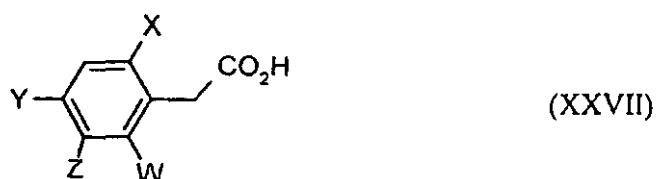
15 其中

A、B 和 W¹ 各如上定义，和

Hal 表示卤素(特别是氯或溴)

(参见，例如，M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. William, J. Chem. Soc. Commun., (1987), 1228).

式(XXXII)化合物是新的。式(XXXII)化合物也可以如下获得：在醇和脱水剂(例如浓硫酸)存在下，将式(XXVII)化合物



5 其中

W、X、Y和Z 各如上定义，

或醇用式(XXIV)化合物酰化(Chem. Reviews 52, 237-416(1953))

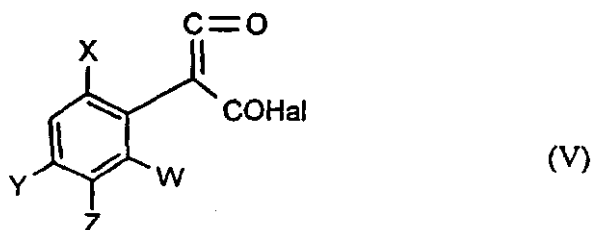


10 其中

W、X、Y、Z和Hal 各如上定义。

一些式(XXXVI)的苄硫基-酰基卤是已知的和/或它们可以用已知的方法制备(J. Antibiotics(1983), 26, 1589).

需在方法(D)、(E)和(F)中作为起始原料的式(V)的卤代羧基烯酮
15 是新的。它们可以通过原则上已知的方法制备(参见,例如,Org. Prep. Proced. Int., 7, (4), 155-158, 1975 和 DE 1 945 703)。因此,例如,式(V)化合物



20 其中

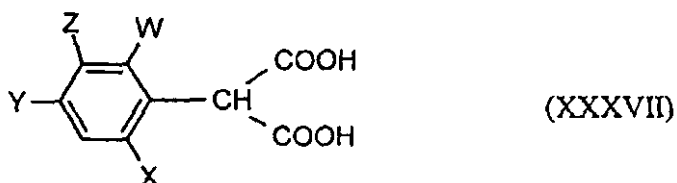
W、X、Y 和 Z 各如上定义，且

Hal 表示氯或溴

如下获得

使式 (XXXVII) 的取代的苯基丙二酸

5



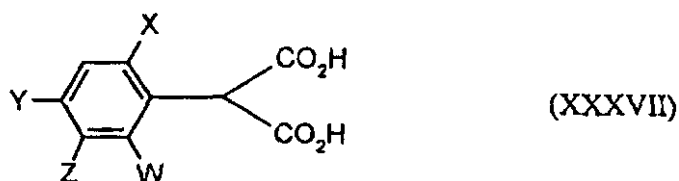
其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义

与酰基卤，例如，亚硫酸氯、五氯化磷(V)、三氯化磷(III)、草酰氯、
10 光气或亚硫酸溴，如果适宜在催化剂如二甲基甲酰胺、甲基-steryl-
甲酰胺或三苯基磷存在下，和如果适宜在碱如吡啶或三乙胺存在下，
进行反应。

式 (XXXVII) 的取代的苯基丙二酸是新的。它们可以用简单的方法
制备（参见，例如，Organikum, VEB Deutscher Verlag der
15 Wissenschaften, 柏林 1977, p.517 ff, EP-A-528 156, WO
97/36868, WO 97/01535 和 WO 98/05638）。

因此，式 (XXXVII) 的苯基丙二酸



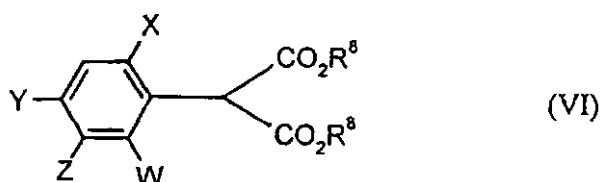
20 其中

W、X、Y 和 Z 各如上定义

如下获得

先将式 (VI) 的苯基丙二酸酯

25

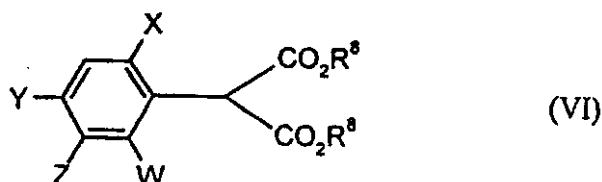


其中

W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义

- 5 在碱存在下和在溶剂中水解，随后小心酸化 (EP-528 156、WO 97/36868、WO 97/01535)。

式 (VI) 的丙二酸是新的



- 10 其中

W、X、Y、Z 和 R^8 各如上定义。

它们可以通过一般已知的有机化学方法制备(参见，例如，《四面体通讯》[Tetrahedron Lett.] 27, 2763(1986)和 Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, 柏林 1977, p.587ff.).

- 15 一些需在本发明方法 (D) 中作为起始原料的式 (VII) 胍是已知的

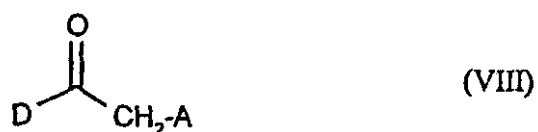


其中

A 和 D 各如上定义，

- 20 和/或它们可以通过由文献已知的方法制备(参见，例如，Liebigs Ann. Chem. 585, 6(1954); Reaktionen der organischen Synthese, C. Ferri, p.212, 513; Georg Thieme Verlag Stuttgart, 1978; Liebigs Ann. Chem. 443, 242(1925); Chem. Ber. 98, 2551(1965), EP-508 126).

需在本发明方法 (E) 中作为起始原料的式 (VIII) 的羧基化合物



其中

- 5 A 和 D 各如上定义
或式 (VIIIa) 的其甲硅烷基烯醇醚

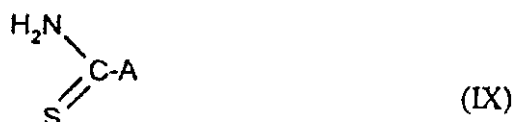


其中

- 10 A、D 和 R^8 各如上定义

是商业可得的通常已知化合物或可以用已知方法获得的化合物。

需在本发明方法 (F) 中作为起始原料的式 (V) 的烯酮酰基氯的制备在上文中已作了描述。进行方法 (F) 所需的式 (IX) 的硫代酰胺



15

其中

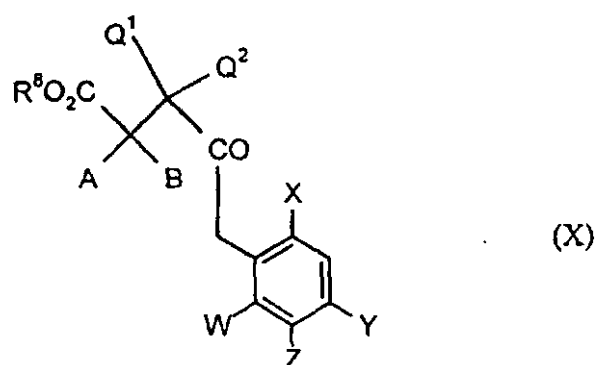
A 如上定义

是有机化学上通常已知的化合物。

需在上述方法 (G) 中作为起始原料的式 (X) 化合物是新的

20

25

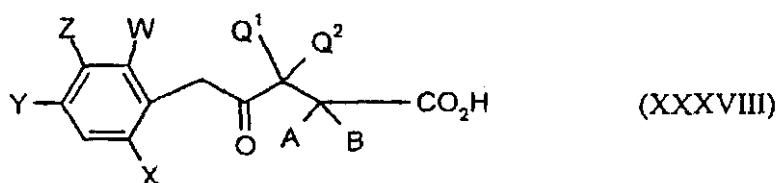


其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 各如上定义。

5 它们可以用原则上已知的方法制备。

式(X)化合物如下获得, 例如, 将式(XXXVIII)化合物酯化(参见, 例如, Organikum, 15th, 柏林, 1977, p. 499)或烷基化(参见制备实施例)

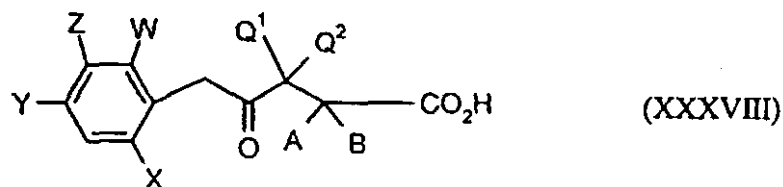


10

其中

W、X、Y、Z、A、B、Q¹ 和 Q² 各如上定义。

式(XXXVIII)化合物是新的



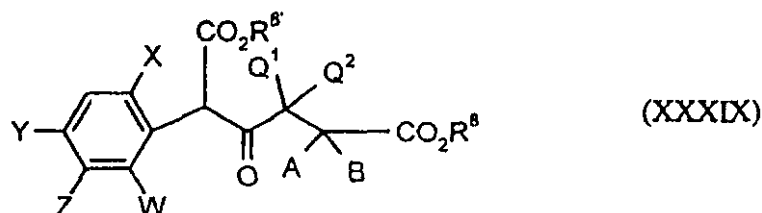
15

其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y 和 Z 各如上定义,

但它们可以通过原则上已知的方法制备(参见制备实施例)。

式(XXXVIII)的 5-芳基-4-酮羧酸如下获得, 例如, 使式(XXXIX)的 2-苯基-3-氧代-己二酸酯



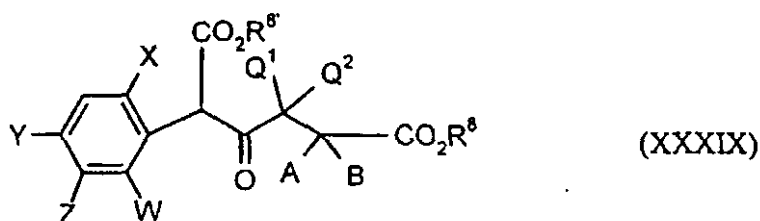
5 其中

A、B、D¹、D²、W、X、Y 和 Z 各如上定义, 和

R⁸和 R^{8'}各表示烷基(特别是 C₁-C₈-烷基)

如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在碱或酸存在下, 进行脱羧酸反应(参见, 例如, Organikum, 15th, 柏林, 1977, pp. 519-521).

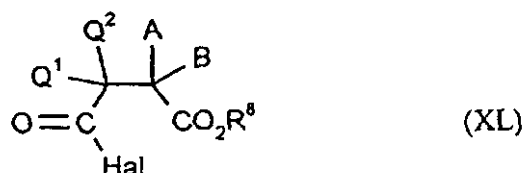
10 式(XXXIX)化合物是新的



其中

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z、R⁸和 R^{8'}各如上定义.

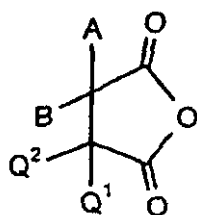
15 式(XXXIX)化合物如下获得, 例如, 将式(XL)的二羧酸单酯酰基
氯



其中

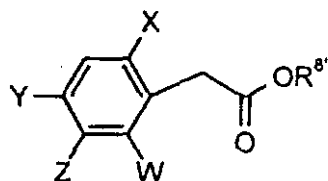
20 A、B、Q¹、Q²和 R⁸各如上定义和

Hal 表示氯或溴,
或式(XLI-A)的羧酸酐



(XLI-A)

- 5 其中
A、B、Q¹和Q²各如上定义,
用式(XXXII)的苯基乙酸酯酰化

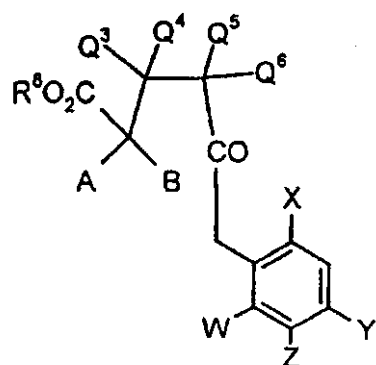


(XXXII)

- 10 其中
W、X、Y、Z和R⁸如上定义,

反应在稀释剂存在下和在碱存在下进行(参见,例如, M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, 参见, 制备实施例)。

- 15 一些式(XL)和(XLI-A)化合物是已知的或是商业可得的有机化学化合物, 和/或它们可以用简单的方式用原则上已知的方法制备。
需在方法(H)中作为起始原料的式(XI)化合物是新的



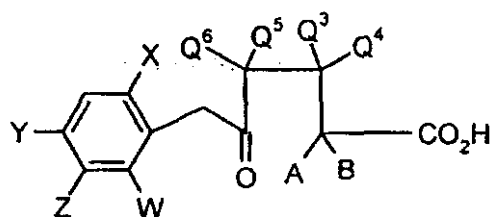
(XI)

其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y、Z 和 R⁸ 各如上定义。

它们可以用原则上已知的方法制备。

- 5 式(XI)的 6-芳基-5-酮羧酸酯如下获得, 例如, 将式(XLII)的 6-芳基-5-酮羧酸酯化(参见, 例如, Organikum, 15th edition, 柏林, 1977, p. 499)

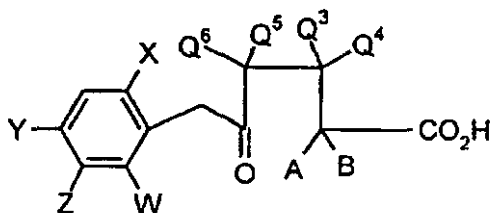


(XLII)

10 其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义。

式(XLII)化合物是新的



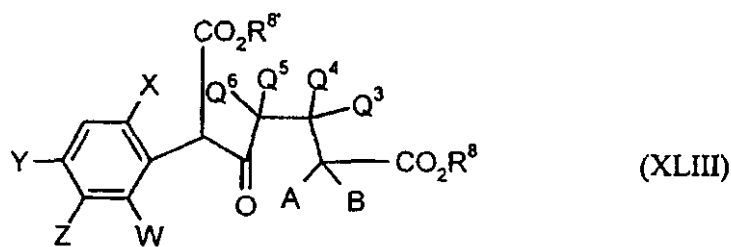
(XLII)

15 其中

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义。

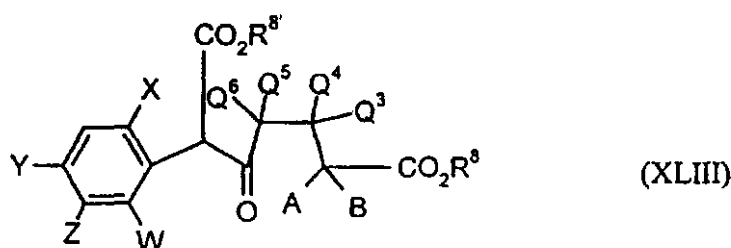
它们可以通过原则上已知的方法制备, 例如, 通过将式(XLIII)的取

代的 2-苯基-3-氧代-庚二酸酯



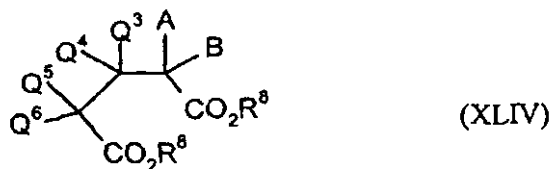
其中

- 5 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义，和 R⁸ 和 R^{8'} 各表示烷基（优选 C₁-C₆-烷基），水解或脱羧酸，如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在碱或酸存在下进行（参见，例如，Organikum, 15th edition, 柏林，1977, pp. 519-521）（另可参见制备实施例）。
- 10 式 (XLIII) 化合物是新的



其中

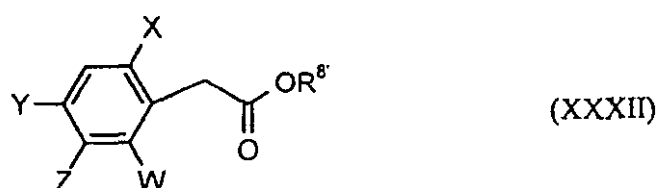
- 15 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y、Z、R⁸ 和 R^{8'} 各如上定义，它们可以如下获得，例如，在稀释剂存在下和在碱存在下，将式 (XLIV) 的二羧酸酯



其中

A、B、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 和 R^8 各如上定义

与式(XXXII)的取代的苯基乙酸酯缩合(参见, 制备实施例)

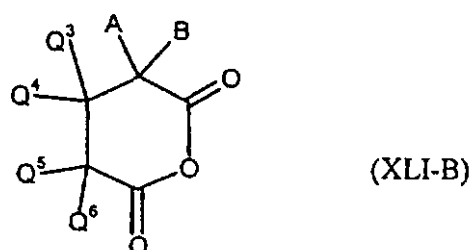


5 其中

W、X、Y、Z和 R^8 各如上定义。

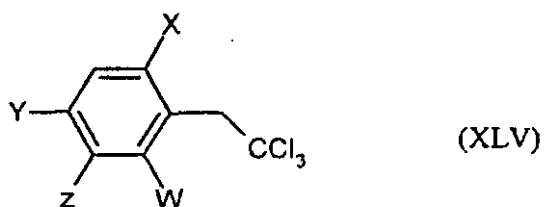
一些式(XLIV)化合物是已知的, 和/或它们可以通过已知的方式制备。

除了式(XLIV)化合物之外, 也可以采用相应的酸酐, 之后反应与
10 制备式(X)化合物时那样进行, 其中式(XLI-B)的酸酐用作起始原料。
一些式(XLI-B)化合物是已知的, 或是商业可得的化合物。



式(XXXII)化合物已描述于方法(B)的前体制备中。

15 式(XXXII)化合物可以通过如下方式获得, 例如, 先使式(XLV)的
取代的 1, 1, 1-三氯-2-苯基乙烷

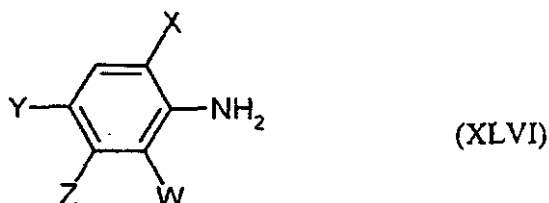


其中

20 W、X、Y和Z各如上定义,

在稀释剂(例如由醇盐衍生的醇)存在下, 在 0℃ 至 150℃ 的温度下, 优选在 20℃ 至 120℃ 下, 与醇盐(例如, 碱金属醇盐如甲醇钠或乙醇钠)反应, 随后在 -20℃ 至 150℃, 优选在 0℃ 至 100℃ 下, 与酸(优选无机酸, 例如, 硫酸)反应(参见, DE 3 314 249).

- 5 式(LXV)化合物是新的; 它们可以通过原则上已知的方法制备.
式(XLV)化合物如下获得, 例如, 式(XLVI)的苯胺



其中

- 10 W、X、Y 和 Z 各如上定义,
在式(XLVII)的烷基脒存在下



其中

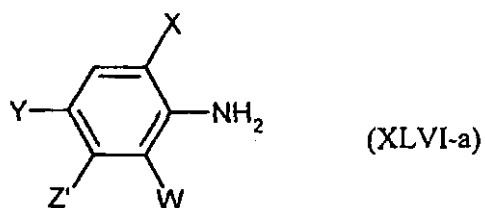
- 15 R^{21} 表示烷基, 优选 C_1-C_6 -烷基,
在氯化铜(II)存在下, 如果适宜在稀释剂(例如脂族脒如乙脒存在下), 在 -20℃ 至 80℃, 优选 0℃ 至 60℃ 温度下, 与二氯乙烯($CH_2=CCl_2$)反应.

- 20 式(XLVII)化合物是有机化学已知的化合物. 氯化铜(II)和二氯乙烯是早就知道的且是商业可得的.

一些式(XLVI)的苯胺是新的.

式(XLVI)的苯胺如下获得, 例如, 在溶剂、碱和催化剂(优选钨配合物, 如, 四(三苯基膦)钨)存在下, 使式(XLVI-a)的苯胺

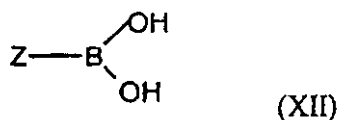
25



其中

W、X 和 Y 各如上定义，和

- 5 Z' 表示氯或溴，优选溴，
与式 (XII) 的硼酸反应



其中

- 10 Z 如上定义。

式 (XLVI-a) 的苯胺是已知的化合物，或它们可以用已知的方法制备。

- 需在上述方法 (I) 中作为起始原料的一些其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X 和 Y 各如上定义且 Z' 表示氯和溴的式 (I-1'-a) 至 (I-8'-a) 的化合物是已知的 (WO 96/35 664、WO 97/02 243 和 WO 98/05 638) 或它们可以用描述于其中的方法或通过方法 (A) 至 (H) 制备。

一些式 (XII) 的硼酸



20

其中

Z 如上定义

是商业可得的，或它们可以通过一般已知的方法用简单地方式制备。

需在本发明方法 (J)、(K)、(L)、(M)、(N)、(O) 和 (P) 中作为起

始原料的式(XIII)的酰基卤、式(XIV)的羧酸酐、式(XV)氯甲酸酯或氯甲酸硫代酯、式(XVI)的氯单硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯、式(XVII)磺酰氯、式(XVIII)的磷化合物、式(XIX)和(XX)的金属氢氧化物、金属醇盐或胺和式(XXI)的异氰酸酯和式(XXII)的氨基甲酰氯是
5 有机或无机化学上通常已知的化合物。

而且, 式(VII)、(VIII)、(IX)、(XIII)至(XXIII)、(XXVI)、(XXVIII)、(XXX)、(XXXVI)、(XL)、(XLI)和(XLIV)化合物由开头所引述的专利申请已知, 和/或其中给出的方法制备。

方法(A)的特征在于, 其中A、B、D、W、X、Y、Z和R⁸各如上定义的式(II)化合物在碱存在下进行分子内缩合。
10

适合于本发明方法(A)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂, 优选的是烃类, 如甲苯和二甲苯, 以及醚类, 如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚, 而且还有极性溶剂, 如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和N-甲基-吡咯烷酮, 以及醇类, 如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。
15

适合于进行本发明方法(A)的碱(脱质子剂)是所有的常规质子受体, 优选的是使用碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐, 如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 它还可以在相转移催化剂存在下采用, 如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或TDA 1(=三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾。再者, 碱金属和碱土金属氧化物或氢氧化物, 如氧化钠、氢化钠和氢化钙, 另外还可以使用碱金属醇盐, 如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。
20

当进行本发明方法(A)时, 反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常, 反应是在0℃至250℃, 优选在50℃至150℃间的温度下。
25

本发明方法(A)通常在常压下进行。

进行本发明方法(A)时, 反应组分式(II)和脱质子碱通常采用大约双倍摩尔量。然而, 还可以过量使用一种或另一种组分(至多达3摩尔)。

方法(B)的特征在于, 其中A、B、W、X、Y、Z和R⁸各如上定义的式(III)化合物在稀释剂和碱存在下进行分子内缩合。
30

适合于本发明方法(B)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂, 优选的

是使用烃类，如甲苯和二甲苯，以及醚类，如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚，以及极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮，和醇类，如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

- 5 适合于进行本发明方法(B)的碱(脱质子剂)是所有的常规质子受体。优选的是使用碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐，如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙，它还可以在相转移催化剂存在下采用，如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或 TDA 1(=三(甲
- 10 氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾。再者，碱金属和碱土金属氯化物或氢化物，如氯化钠、氯化钾和氯化钙，另外还可以使用碱金属醇盐，如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

当进行本发明方法(B)时，反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常，反应是在 0℃ 至 250℃，优选在 50℃ 至 150℃ 间的温度下。

- 15 本发明方法(B)通常在常压下进行。

进行本发明方法(B)时，反应组分式(III)和脱质子碱通常采用大约等摩尔量。然而，还可以过量使用一种或另一种组分(至多达 3 摩尔)。

- 方法(C)的特征在于，其中 A、B、W、X、Y、Z 和 R⁹ 各如上定义的
- 20 式(IV)化合物在酸存在下和如果适宜在稀释剂存在下进行分子内环化。

- 适合于本发明方法(C)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是使用烃类，如甲苯和二甲苯，以及卤代烃类，如二氯甲烷、氯仿、二氯乙烷、氯苯、二氯苯，以及极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二
- 25 甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮，和醇类，如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

如果适宜，所使用的酸也可以用作稀释剂。

- 适宜于本发明方法(C)的酸是所有的常规无机或有机酸，如氢卤酸类、硫酸、烷基-、芳基-和卤代烷基-磺酸，特别是卤代烷基羧
- 30 酸，如三氯乙酸。

当进行本发明方法(C)时，反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常，反应是在 0℃ 至 250℃，优选在 50℃ 至 150℃ 间的温度下。

本发明方法(C)通常在常压下进行。

进行本发明方法(C)时,反应组分式(IV)和酸采用例如等摩尔量。然而,如果适宜还可以使用所述酸作为溶剂或作为催化剂。

方法(D- α)和(D- β)的特征在于,如果适宜在碱存在下和如果适宜在稀释剂存在下,使其中W、X、Y、Z、R⁸和Hal各如上定义的式(V)或(VI)化合物与其中A和D各如上定义的式(VII)化合物反应。

适合于本发明方法(D- α)和(D- β)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是烃类,如甲苯和二甲苯,以及醚类,如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚,而且还有极性溶剂,如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和N-甲基-吡咯烷酮,以及在采用式(VI)化合物的情况下,可以是醇类,如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

当采用式(V)化合物时,适宜的碱是无机碱,尤其是碱金属和碱土金属碳酸盐,如碳酸钠、碳酸钾或碳酸钙,以及有机碱,如吡啶或三乙胺;而当采用式(VI)化合物时,适宜的碱是碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐,如氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙,它还可以在相转移催化剂存在下采用,如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或TDA 1(=三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾,碱金属和碱土金属氮化物或氢化物,如氮化钠、氮化钾和氮化钙,另外还可以使用碱金属醇盐,如甲醇钠和叔丁醇钾。

当进行本发明方法(D- α)和(D- β)时,反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常,反应是在-20℃至250℃,优选在0℃至150℃间的温度下进行。

25 本发明方法(D- α)和(D- β)通常在常压下进行。

进行本发明方法(D- α)和(D- β)时,反应组分式(V)和(VII)或(VI)和(VII)和任选地使用的脱质子碱通常采用大约等摩尔量。然而,还可以过量使用一种或另一种组分(至多达3摩尔)。

30 方法(E)的特征在于,在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下,使式(VIII)羰基化合物或式(VIII-a)的其烯醇醚与式(V)的烯酮酰基卤反应。

适合于本发明方法(E)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的

是使用烃类，如甲苯和二甲苯，以及醚类，如二丁醚、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚，以及极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮。

适合于本发明方法 (E) 的酸受体是所有的常规酸受体。

- 5 优选的是使用叔胺，如三乙胺、吡啶、二氮杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环十一烷 (DBU)、二氮杂二环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N,N-二甲基-苯胺。

当进行本发明方法 (E) 时，反应温度可以在相对宽的范围进行。通常，反应是在 0℃ 至 250℃，优选在 50℃ 至 220℃ 间的温度下。

- 10 本发明方法 (E) 通常在常压下进行。

进行本发明方法 (E) 时，其中 A、D、W、X、Y 和 Z 各如上定义且 Hal 表示卤素的式 (VIII) 和 (V) 反应组分和如果适宜酸受体通常采用大约等摩尔量。然而，还可以相对大地过量使用一种或另一种组分 (至多达 5 摩尔)。

- 15 方法 (F) 的特征在于，式 (IX) 的硫代酰胺与式 (V) 的烯酮酰基卤在稀释剂存在下和如果适宜在酸受体存在下进行反应。

适合于本发明方法 (F) 的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是使用烃类，如甲苯和二甲苯，以及醚类，如二丁醚、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚，以及极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮。

- 20 适合于本发明方法 (F) 的酸受体是所有的常规酸受体。

优选的是使用叔胺，如三乙胺、吡啶、二氮杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环十一烷 (DBU)、二氮杂二环壬烯 (DBN)、Hünig 碱和 N,N-二甲基-苯胺。

- 25 当进行本发明方法 (F) 时，反应温度可以在相对宽的范围进行。通常，反应是在 0℃ 至 250℃，优选在 20℃ 至 220℃ 间的温度下进行。

本发明方法 (F) 通常在常压下进行。

- 30 进行本发明方法 (F) 时，其中 A、W、X、Y 和 Z 各如上定义和 Hal 表示卤素的式 (IX) 和 (V) 反应组分和任选使用的酸受体通常采用大约等摩尔量。然而，还可以过量使用一种或另一种组分 (至多达 5 摩尔)。

方法 (G) 的特征在于，其中 A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z 和 R⁸ 各如

上定义的式(X)化合物在碱存在下进行分子内缩合。

适合于本发明方法(G)的稀释剂是所有的对反应参与者为惰性的有机溶剂。优选的是烃类，如甲苯和二甲苯，以及醚类，如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚，而且还有极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮，以及可以是醇类，如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适合于进行本发明方法(G)的碱(脱质子剂)是所有的常规质子受体。优选的是使用是碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐，如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙，它还可以在相转移催化剂存在下采用，如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或 TDA 1(=三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)。也可以使用碱金属如钠和钾。再者，还有碱金属和碱土金属氯化物或氢化物，如氯化钠、氯化钾和氯化钙，另外还可以使用碱金属醇盐，如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

当进行本发明方法(G)时，反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常，反应是在-75℃至 250℃，优选在-50℃至 150℃间的温度下。

本发明方法(G)通常在常压下进行。

进行本发明方法(G)时，式(X)反应组分和脱质子碱通常采用大约等摩尔量。然而，还可以过量使用一种或另一种组分(至多达 3 摩尔)。

方法(H)的特征在于，其中 A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y、Z 和 R⁸ 各如上定义的式(XI)在碱存在下进行分子内缩合。

适合于本发明方法(H)的稀释剂是所有的惰性有机溶剂。优选的是烃类，如甲苯和二甲苯，以及醚类，如二丁醚、四氢呋喃、二噁烷、乙二醇二甲基醚和二甘醇二甲基醚，而且还有极性溶剂，如二甲亚砜、环丁砜、二甲基甲酰胺和 N-甲基-吡咯烷酮，以及可以是醇类，如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、异丁醇和叔丁醇。

适合于进行本发明方法(H)的碱(脱质子剂)是所有的常规质子受体。优选的是碱金属和碱土金属氧化物、氢氧化物和碳酸盐，如氢氧化钠、氢氧化钾、氧化镁、氧化钙、碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙，它还可以在相转移催化剂存在下采用，如三乙基苄基氯化铵、四丁基溴化

铵、Adogen 464(=甲基三烷基(C₈-C₁₀)氯化铵或 TDA 1(-三(甲氧基乙氧基乙基)-胺)、也可以使用碱金属如钠和钾。再者,还有碱金属和碱土金属氧化物或氢化物,如氧化钠、氢氧化钠和氢氧化钙,另外还可以使用碱金属醇盐,如甲醇钠、乙醇钠和叔丁醇钾。

5 当进行本发明方法(H)时,反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常,反应是在0℃至250℃,优选在50℃至150℃间的温度下。

本发明方法(H)通常在常压下进行。

进行本发明方法(H)时,式(XII)反应组分和脱质子碱通常采用大约等摩尔量。然而,还可以过量使用一种或另一种组分(至多达3摩尔)。

10 进行本发明方法(I)时,钇(0)配合物适合作为催化剂。优选的是例如四(三苯基膦)钇。如果适宜,也可以使用钇(II)化合物,如氯化钇(II)。

适合于本发明方法(I)的酸受体是无机或有机碱。优选的碱包括
15 碱土金属或碱金属氢氧化物、乙酸盐、碳酸钠或碳酸氢盐,如氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钡或氢氧化铵、乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙或乙酸铵、碳酸钠、碳酸钾或碳酸铵、碳酸氢钠或碳酸氢钾,碱金属氟化物,如,氟化铯,以及叔胺,如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基吡啶、N-甲基吗啉、N,N-
20 二甲基氨基吡啶、二氮杂双环辛烷(DABCO)、二氮杂双环壬烷(DBN)或二氮杂双环十一碳烯(DBU)。

适合于进行本发明方法(I)的稀释剂是水、有机溶剂及其任一种混合物。实例包括:脂族、脂环族或芳族烃类,如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氢化萘;卤代烃类,
25 如氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、三氯乙烷或四氯乙烯;醚类,如乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、二甘醇二甲基醚或苯甲醚;醇类,如甲醇、乙醇、正-或异丙醇、正-、异-、仲-和叔-丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧基乙醇、甲氧基乙
30 醇、二甘醇单甲醚、二甘醇单乙醚;水。

当进行本发明方法(I)时,反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常,反应是在0℃至140℃,优选在50℃至100℃间的温度下。

进行本发明方法(I)时, 其中 Z 如上定义的式(XII)硼酸和其中 A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、W、X、Y 和 Z 各如上定义的式(I-1-a)至式(I-8-a)化合物以 1: 1 至 3: 1、优选以 1: 1 至 2: 1 的摩尔比使用。每摩尔的式(I-1-a)至(I-8-a)化合物通常采用 0.005 至 0.5 摩尔, 优选 0.01 至 0.1 摩尔催化剂。通常过量使用碱。

方法(J-α)的特征在于, 式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XIII)的酰基卤反应, 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下反应。

适合于本发明方法(J-α)的稀释剂是所有的对酰基卤惰性的溶剂。优选使用烃类, 如汽油、苯、甲苯、二甲苯和四氯化苯, 以及卤代烃类, 如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯, 还有酮类, 如丙酮和甲基异丁基酮, 以及醚类, 如乙醚、四氢呋喃和二噁烷, 另外还有羧酸酯类, 如乙酸乙酯, 以及强极性溶剂, 如二甲亚砷和环丁砷。如果酰基卤的水解稳定性许可, 反应还可以在水中进行。

适合于本发明方法(J-α)的酸结合剂是所有的常规酸受体。优选的是使用叔胺, 如三乙胺、吡啶、二氮杂双环辛烷(DABCO)、二氮杂双环十一碳烯(DBU)、二氮杂双环壬烯(DBN), Hünig 碱和 N,N-二甲基-苯胺, 以及碱土金属氧化物, 如氧化镁和氧化钙, 而且还有碱金属和碱土金属碳酸钠, 如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 以及碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾。

当进行本发明方法(J-α)时, 反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常, 反应是在-20℃至+150℃, 优选在 0℃至 100℃间的温度下。

进行本发明方法(J-α)时, 式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料和式(XIII)酰基卤在每一种情况下通常采用大约等摩尔量。然而, 还可以相对大过量(至多达 5 摩尔)地使用酰基卤。后处理是通过常规方法进行的。

方法(J-β)的特征在于, 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物与式(XIV)的羧酸酐反应。

对本发明方法(J-β)而言优选的稀释剂是那些当使用酰基卤时为优选的稀释剂。而且, 也可能过量使用羧酸同时作为稀释剂。

在本发明方法(J-β)中, 如果适宜加入的酸结合剂, 优选是使用酰基卤时亦是优选的酸结合剂。

5 在本发明方法(J-β)中, 反应温度可以在相对宽的范围内变化。通常, 反应是在-20℃至+150℃, 优选是在0℃至100℃间的温度下进行。

进行本发明方法(J-β)时, 式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料和式(XIV)酸酐在每一种情况下通常采用大约等摩尔量。然而, 还可以相对大过量(至多达5摩尔)地使用酰基卤。后处理是通过常规方法进行的。

10 通常, 采用的步骤是去除稀释剂和过量的羧酸酐, 以及通过蒸馏或通过用有机溶剂或用水洗涤形成的羧酸。

方法(K)的特征在于, 如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下, 使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XV)的氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯反应。

15 适合于本发明方法(K)的酸结合剂是所有的常规酸受体。优选的是使用叔胺, 如三乙胺、吡啶、DABCO、DBU、DBA, Hünig碱和N,N-二甲基-苯胺, 以及碱土金属氧化物, 如氧化镁和氧化钙, 而且还有碱金属和碱土金属碳酸盐, 如碳酸钠、碳酸钾和碳酸钙, 以及碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾。

20 适合于本发明方法(K)的稀释剂是所有的对氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯惰性的溶剂。优选使用烃类, 如汽油、苯、甲苯、二甲苯和四氯化苯, 以及卤代烃类, 如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯, 还有酮类, 如丙酮和甲基异丁基酮, 以及醚类, 如乙醚、四氢呋喃和二噁烷, 另外还有羧酸酯类, 如乙酸乙酯, 以及强极性溶剂, 如二甲亚砜和环丁砜。

25 当进行本发明方法(K)时, 反应温度可以在相对宽的范围内进行。通常, 反应是在-20℃至+100℃, 优选在0℃至50℃间的温度下进行。

本发明方法(K)通常是在常压下进行的。

30 进行本发明方法(K)时, 式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料和适宜的式(XV)氯甲酸酯或氯甲酸硫醇酯在每一种情况下通常采用大约等摩尔量。然而, 还可以相对大过量(至多达2摩尔)地使用一种或另一种

组分。后处理是通过常规方法进行的。通常，去除沉淀出的盐且余下的反应混合物通常汽提掉稀释剂来浓缩。

5 本发明方法(L)的特征在于，在稀释剂存在下，和如果适宜在酸结合剂存在下，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XVI)化合物反应。

在制备方法(L)中，大约1摩尔的式(XVI)的氯单硫代甲酸酯或氯二硫代甲酸酯与每摩尔的式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料在0至120℃，优选20至60℃反应。

10 如果适宜加入的稀释剂，是所有的极性有机溶剂，如醚类、酰胺类、砜类、亚砜类，也可以是卤代烷类。

优选的是使用二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在优选的实施方案中，如果通过加入强脱质子剂如氢化钠或叔丁醇钾来制备式(I-1-a)至(I-8-a)化合物的烯醇盐，则不需要加入另外的酸结合剂。

15 如果采用酸结合剂，则是常规无机或有机碱，例如，氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

反应可以在常压下进行，或在加压下进行，优选是在常压下进行。后处理是通过常规方法进行。

20 本发明方法(M)的特征在于，如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XVII)的磺酰氯反应。

在制备方法(M)中，大约1摩尔式(XVII)的磺酰氯与每摩尔的式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料在-20至150℃，优选在20至70℃的温度下进行反应。

25 如果适宜加入的适合的稀释剂是所有的惰性极性有机溶剂，如醚类、酰胺类、腈类、砜类、亚砜类或卤代烃类如二氯甲烷。

优选的是使用二甲基亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

30 在优选的实施方式中，如果通过加入强脱质子剂如氢化钠或叔丁醇钾来制备式(I-1-a)至(I-8-a)化合物的烯醇盐，则不需要加入另外的酸结合剂。

如果采用酸结合剂，则是常规无机或有机碱，例如，氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

反应可以在常压下进行，或在加压下进行，优选是在常压下进行。后处理是通过常规方法进行。

本发明方法(N)的特征在于，如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物在每一种情况下与式(XVIII)磷化合物反应。

在制备方法(N)中，在 -40°C 和 150°C 、优选 -10 和 110°C 之间，使1至2、优选1至1.3摩尔式(XVIII)磷化合物与1摩尔化合物(I-1-a)至(I-8-a)反应。

如果适宜加入的适合的溶剂是所有的惰性极性有机溶剂，如醚类、酰胺类、腈类、醇类、硫化物、砜类、亚砜类等。

优选使用乙腈、二甲亚砜、四氢呋喃、二甲基甲酰胺、二氯甲烷。

如果适宜加入的适合的酸结合剂是常规无机或有机碱如氢氧化物、碳酸盐或胺类。实例包括氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、吡啶、三乙胺。

反应可以在常压或在加压下进行，优选在常压下进行。后处理是通过有机化学的常规方法进行。终产物优选通过结晶、色谱纯化或通过所谓“初蒸馏”，即，在减压下去除挥发性组分，进行纯化。

方法(O)的特征在于，如果适宜在稀释剂存在下，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物与式(XIX)的金属氢氧化物或金属醇盐或式(XX)的胺反应。

对本发明方法(O)优选的稀释剂是醚类如四氢呋喃、二噁烷、乙醚，或醇类如甲醇、乙醇、异丙醇，也可以是水。

本发明方法(O)通常在常压下进行。

反应温度通常在 -20°C 至 100°C ，优选在 0°C 至 50°C 。

本发明方法(P)的特征在于，使式(I-1-a)至(I-8-a)化合物，(P- α)如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在催化剂存在下与式(XXI)的化合物反应，或(P- β)在如果适宜在稀释剂存在下和如果适宜在酸结合剂存在下与式(XXII)化合物反应。

在制备方法(P- α)中，在 0 至 100°C 、优选在 20 至 50°C 下，大约1摩尔式(XXI)异氰酸酯与每摩尔式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料反应。

如果适宜加入的适合的稀释剂是所有惰性有机溶剂，如醚类、酰

胺类、腈类、砷类、亚砷类。

如果适宜，可以加入催化剂来加速反应。非常优越的是，所采用的催化剂是有机锡化合物，如二月桂酸二丁基锡。反应优选是在常压进行。

- 5 在制备方法(P-β)中，在-20至150℃，优选在0至70℃下，使大约1摩尔式(XXII)氨基甲酰氯与每摩尔的式(I-1-a)至(I-8-a)起始原料反应。

如果适宜加入的适合的稀释剂是所有的惰性有机溶剂，如醚类、酰胺类、砷类、亚砷类或卤代烃类。

- 10 优选的是使用二甲基亚砷、四氢呋喃、二甲基甲酰胺或二氯甲烷。

在优选的实施方案中，如果式(I-1-a)至(I-8-a)的烯醇盐通过加入强脱质子剂(如，氢化钠或叔丁醇钾)形成，则不需要加入另外的酸结合剂。

- 15 如果采用酸结合剂，则它们是常规的无机或有机碱，例如，氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、三乙胺或吡啶。

反应可以在常压或加压下进行，且优选是在常压下进行。后处理是通过常规方法进行。

- 20 本发明活性化合物适合防治动物害虫，优选节肢动物和线虫，特别是出现在农业、森林、贮藏产品和材料保护以及卫生方面上的昆虫、螨。它们对正常的敏感和抗性种类和对所有或某些生长发育阶段有活性。上述害虫包括：

等足目，例如，潮虫(*Oniscus asellus*)、鼠妇(*Armadillidium vulgare*)和斑鼠妇(*Porcellio scaber*)。

- 25 倍足目，例如，具斑马陆(*Blaniulus guttulatus*)。

唇足目，例如，食果地蜈蚣(*Geophilus carpophagus*)和蚰蜒(*Scutigera spec*)。

综合目，例如，洁么蚰(*Scutigera immaculata*)。

缨尾目，例如，西洋衣鱼(*Lepisma saccharina*)。

- 30 弹尾目，例如，具棘跳虫(*Onychiurus armatus*)。

直翅目，例如，东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)。

德国小蠊 (*Blattella germanica*)、家蟋蟀 (*Acheta domesticus*)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.)、热带飞蝗 (*Locusta migratoria migratorioides*)、殊种蚱蜢 (*Melanoplus differentialis*) 和沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)。

5 革翅目, 例如, 欧洲球蝽 (*Forficula auricularia*)。

等翅目, 例如, 犀白蚁属 (*Reticulitermes* spp.)。

虱目, 例如, 美核桃根瘤蚜 (*Phylloxera vastatrix*)、瘿绵蚜属 (*Pemphigus* spp.)、体虱 (*Pediculus humanus corporis*)、血虱属 (*Haematopinus* spp.) 和颈虱属 (*Linognathus* spp.)。

10 食毛目, 例如, 啮毛虱属 (*Trichodectes* spp.) 和畜属虱 (*Damalinea* spp.)。

缨翅目, 例如, *Frankliniella occidentalis*、温室条蓟马 (*Hercinothrips femoralis*)、*Thrips palmi* 和棉蓟马 (*Thrips tabaci*)。

15 半翅目, 例如, 扁盾蝽属 (*Eurygaster* spp.)、中棉红蝽 (*Dysdercus intermedius*)、甜菜拟网蝽 (*Piesma quadrata*)、温带臭蝽 (*Cimex lectularius*)、长红猎蝽 (*Rhodnius prolixus*) 和锥蝽属 (*Triatoma* spp.)。

同翅目, 例如, 甘蓝粉虱 (*Aleurodes brassicae*)、甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*)、温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、茶藨隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、苹果蚜 (*Doralis pomi*)、苹果绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*)、麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、瘤额蚜属 (*Myzus* spp.)、忽布疣蚜 (*Phorodon humili*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、微叶蝉属 (*Empoasca* spp.)、钝鼻叶蝉 (*Euscelis bilobatus*)、黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*)、水土坚蚧 (*Lecanium corni*)、油橄榄黑蚧 (*Saissetia oleae*)、灰稻虱 (*Laodelphax striatellus*)、稻褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、红肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、夹竹桃园蚧 (*Aspidiotus hederae*)、粉蚧属 (*Pseudococcus* spp.) 和木虱属 (*Psylla* spp.)。

20

25

30

鳞翅目，例如，棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*)、松天蛾(*Bupalus piniarius*)、冬尺蛾(*Cheimatobia brumata*)、苹细蛾(*Lithocolletis blancardella*)、苹果巢蛾(*Hyponomeuta padella*)、小菜蛾(*Plutella maculipennis*)、天幕毛虫
5 (*Malacosoma neustris*)、黄毒蛾(*Euproctis chrysorrhoea*)、毒蛾属(*Lymantria* spp.)、棉潜蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、桔潜叶蛾(*Phyllocnistis citrella*)、地老虎属(*Agrotis* spp.)、切根虫属(*Euxoa* spp.)、夜蛾属(*Feltia* spp.)、棉斑实蛾(*Earias insulana*)、棉铃虫属(*Heliothis* spp.)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、斜纹夜蛾(*Prodenia litura*)、灰翅夜蛾属(*Spodoptera* spp.)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni*)、苹囊蛾(*Carpocapsa pomonella*)、粉蝶属(*Pieris* spp.)、禾草螟属(*Chilo* spp.)、玉米螟(*Pyrausta nubilalis*)、地中海粉斑螟(*Ephestia kuehniella*)、大蜡螟(*Galleria mellonella*)、幕衣蛾(*Tineola bisselliella*)、袋衣蛾(*Tinea pellionella*)、褐织蛾(*Hofmannophila pseudospretella*)、亚麻黄卷蛾(*Cacoecia podana*)、*Capua reticulana*、枞色卷蛾(*Choristoneura fumiferana*)、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)、茶长卷蛾(*Homona magnanima*)和栎绿卷蛾(*Tortrix viridana*)。
15

鞘翅目，例如，具斑窃蠹(*Anobium punctatum*)、谷蠹(*Rhizopertha dominica*)、*Acanthoscelides obtectus*、大豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、赤杨紫跳甲(*Agelasrtica alni*)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、辣根猿叶甲(*Phaedon cochleariae*)、条叶甲属(*Diabrotica* spp.)、油菜蓝跳甲(*Psylliodes chrysocephala*)、墨西哥豆甲(*Epilachna varivestis*)、隐翅甲属(*Atomaria* spp.)、锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*)、花象甲属(*Anthonomus* spp.)、米象属(*Sitophilus* spp.)、葡萄黑耳喙象
25 (*Otiorrhynchus sulcatus*)、香蕉根象甲(*Cosmopolites sordidus*)、甘蓝荚象甲(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、苜蓿叶象虫(*Hypera postica*)、皮蠹属(*Dermestes* spp.)、斑皮蠹属
30

(*Trogoderma* spp.)、圆皮蠹属(*Anthrenus* spp.)、毛蠹属(*Attagenus* spp.)、粉蠹属(*Lyctus* spp.)、油菜花露尾甲(*Meligethes aeneus*)、蛛甲属(*Ptinus* spp.)、金黄蛛甲(*Niptus hololeucus*)、裸蛛甲(*Gibbium psylloides*)、拟谷盗属(*Tribolium* spp.)、黄粉虫(*Tenebrio molitor*)、叩头虫属(*Agriotes* spp.)、宽胸叩头虫属(*Conoderus* spp.)、西方五月鳃角金龟(*Melolontha melolontha*)、马铃薯鳃角金龟(*Amphimallon sostitialis*)和褐新西兰肋翅鳃角金龟(*Costelytra zealandica*)。

膜翅目，例如，锯角叶蜂属(*Diprion* spp.)、叶蜂属(*Hoplocampa* spp.)、田蚁属(*Lasius* spp.)、小家蚁(*Monomorium pharaonis*)和胡蜂(*Vespa* spp.)。

双翅目，例如，伊蚊属(*Aedes* spp.)、按蚊属(*Anopheles* spp.)、库蚊属(*Culex* spp.)、黄猩猩果蝇(*Drosophila melanogaster*)、蝇属(*Musca* spp.)、厕蝇属(*Fannia* spp.)、红头丽蝇(*Callophora erythrocephala*)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、金蝇属(*Chrysomya* spp.)、疽蝇属(*Cuterebra* spp.)、胃蝇属(*Gastrophilus* spp.)、虱蝇属(*Hyppobosca* spp.)、*Liriomyza* spp.、螫蝇属(*Stomoxys* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、塘螂属(*Tannia* spp.)、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、瑞典麦杆蝇(*Oscinella frit*)、草种蝇属(*Phorbia* spp.)、菠菜潜叶花蝇(*Pegomyia hyoscyami*)、地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)、油橄榄实蝇(*Dacus oleae*)和沼泽大蚊(*Tipula paludosa*)。

蚤目，例如，印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*)、毛列蚤属(*Ceratophyllus* spp.)。

蛛形目，例如，蝎(*Scorpio maurus*)和毒寇蛛(*Latrodectus mactans*)。

蜱螨目，例如，粗脚粉螨(*Acarus siro*)、隐喙蜱属(*Argas* spp.)、钝喙蜱属(*Ornithodoros* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、茶瘿螨(*Eriophyes ribis*)、柑桔锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、牛蜱属(*Boophilus* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.)、花蜱属(*Amblyomma* spp.)、玻眼蜱属

(Hyalomma spp.)、硬蜱属(Ixodes spp.)、瘧蟎属(Psoroptes spp.)、皮蟎属(Chorioptes spp.)、疥蟎属(Sarcoptes spp.)、跗线蟎属(Tarsonemus spp.)、苜蓿苔蟎(Bryobia praetiosa)、全爪蟎属(Panonychus spp.)和叶蟎属(Tetranychus spp.)。

- 5 本发明活性化合物的突出之处在于在叶和土壤施用后其强的杀虫和杀蟎活性。

它们可以特别成功地采用来防治损害植物的昆虫，例如防治辣根猿叶甲(Phaedon cochleariae)幼虫、黑尾叶蝉(Nephotettix cincticeps)幼虫或防治桃蚜(Myzus persicae)幼虫。

- 10 本发明活性化合物还可以用作脱叶剂、干燥剂、杀茎秆剂和特别是用作除草剂。所谓的杂草，就其最宽的范围而言，应理解为生长在该不该生长的地方的所有植物。本发明的物质是作为灭生性除草剂或是选择性除草剂基本上取决于所用的量。

- 15 防治杂草所需的本发明活性化合物的剂量介于0.001至10kg/ha，优选介于0.005至5kg/ha之间。

本发明化合物可以与下列植物相关使用：

- 20 下列属的双子叶杂草：芥属、独行草属、猪殃殃属、繁缕属、母菊属、春黄菊属、牛膝属、藜属、苧麻属、千里光属、苋属、马齿苋属、苍耳属、旋花属、甘薯属、蓼属、田菁属、豚草属、蓟属、飞廉属、苦苣菜属、茄属、蔊菜属、节节草属、母草属、野芝麻属、婆婆纳属、苘麻属、刺酸模属、曼陀罗属、堇菜属、鮑瓣花属、罌粟属、矢车菊属、三叶草属、毛茛属和蒲公英属，

- 25 下列属的双子叶作物：棉属、大豆属、甜菜属、胡萝卜属、菜豆属、豌豆属、茄属、亚麻属、甘薯属、野豌豆属、烟草属、蕃茄属、花生属、芸苔属、莴苣属、黄瓜属和南瓜属，

- 30 下列属的单子叶杂草：稗属、狗尾草属、黍属、马唐、梯牧草属、早熟禾属、羊茅属、蟋蟀草属、臂形草属、黑麦草属、雀麦属、燕麦属、莎草属、高粱属、冰草属、狗牙根属、雨久花属、飘拂草属、慈菇属、荸荠属、藎草属、雀稗属、鸭嘴草属、尖瓣花属、龙爪茅属、剪股颖属、看麦娘属和风草属，

下列属的单子叶作物：稻属、玉米属、小麦属、大麦属、燕麦属、黑麦属、高粱属、黍属、甘蔗属、凤梨属、天门冬属和葱属。

然而，本发明化合物的应用决不限于这些属，且也可以相同的方式延伸至其它植物。

取决于化合物的浓度，化合物适合于灭生性防治杂草，例如工业地域和铁道线，以及有或无种植树林的道路和广场。同样，化合物可以用于防治多年生作物中的杂草，例如森林、装饰树林、果园、葡萄园、柑桔林、坚果园、蕉种植园、咖啡种植园、茶园、橡胶种植园、油棕榈种植园、可可种植园、软果林和啤酒花田、草场、草皮和牧场中的杂草，和选择性地防治一年生作物中的杂草。

本发明式(I)化合物特别适合于选择性地以芽前和芽后二种方式防治双子叶作物中的单子叶杂草。它们可以采用非常成功地防治例如棉花或糖用甜菜中的有害禾草。

活性化合物可以转化成常规的制剂，如溶液、乳剂、可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂、喷粉剂、膏剂、水溶性粉剂、颗粒剂、悬浮乳剂、用活性化合物浸渍的天然或合成材料，以及包在聚合物中的微细胶囊。

这些型剂可以用已知的方式生产，例如，将活性化合物与扩充剂，即液体和/或与固体载体混合，并任选使用表面活性剂，即乳化剂和/或分散剂和/或起泡剂。

在用水作扩充剂的情况下，也可以用有机溶剂作助溶剂。作为液体溶剂，适合的主要有：芳族化合物，如二甲苯，甲苯或烷基苯，氯代芳族化合物或氯代脂肪烃，如氯代苯类、氯乙烯类或二氯甲烷，脂肪族烃，如环己烷或石蜡，例如矿物油馏份、矿物和植物油，醇类，如丁醇或乙二醇以及其醚和酯，酮类，如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮，强极性溶剂，如二甲基甲酰胺或二甲基亚砷，以及水。

适合的固体载体是：

例如铵盐和磨碎的天然矿物质如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石或硅藻土，和磨碎的合成矿物质，如高分散二氧化硅、矾土和硅酸盐；用于颗粒剂的固体载体适合的有：例如压碎并分级的天然矿物质如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石，以及有机和无机粉的合成颗粒，和如下有机物的颗粒：锯木屑、椰壳、玉米穗轴和烟茎；适合的乳化剂和/或起泡剂是：例如非离子和阴离子乳化剂，如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如，烷基芳基聚乙二醇醚，烷基磺酸盐，烷基硫酸盐，芳基磺酸盐以及白蛋白水解产

物；适合的分散剂是：例如，木素亚硫酸废液和甲基纤维素。

制剂中可以使用粘合剂如羧甲基纤维素和粉状、颗粒或乳胶形式的天然和合成聚合物，如阿拉伯胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯，以及天然磷脂，如脑磷脂和卵磷脂，和合成磷脂。其它的添加剂可以是矿物油 and 植物油。

也可能使用染料，如无机颜料，例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝，和有机染料，如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料，和微量营养素如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

制剂中通常含有按重量计 0.1 至 95% 的活性化合物，优选 0.5 至 90%。

本发明活性化合物可以其商业上可行的制剂和由这些制剂制备的使用形式作为与如下的其它活性化合物的混合物存在：杀虫剂、引诱剂、杀菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂或除草剂。杀虫剂包括例如磷酸酯类、氨基甲酸酯、羧酸酯类、氯代烃类、苯基脲类、由微生物生产的物质，及其它。

混合物的特别有利的组分是例如下列：

杀真菌剂：

2-氨基丁烷、2-苯胺基-4-甲基-6-环丙基-嘧啶；2',6'-二溴-2-甲基-4'-三氯甲氧基-4'-三氯甲基-1,3-噻唑-5-甲酰苯胺；2,6-二氯-N-(4-三氯甲基苯甲基)苯甲酰胺；(E)-2-甲氧基亚氨基-N-甲基-2-(2-苯氧苯基)乙酰胺；8-羟基喹啉硫酸盐；(E)-2-{2-[6-(2-氯基-苯氧基)嘧啶-4-氧基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯；(E)-甲氧基亚氨基[α -(邻甲苯氧基)-邻甲苯基]乙酸甲酯；2-苯基苯酚(OPP)、艾敌吗啉(alldimorph)、氯丙磷酸、氯丙磷酸钾、敌菌灵、戊环唑、苯霜灵、碘萘灵、苯菌灵、乐杀螨、联苯、双苯三唑醇、灭瘟素、糠菌唑、磺酸丁嘧啶、丁赛特、石硫合剂、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、萎锈灵、甲基克杀螨、地茂散、氯化苦、百菌清、乙菌利、硫杂灵、霜脲氰、环唑醇、酯菌胺、防霉酚、苄氯三唑醇、抑菌灵、哒菌清、氯硝胺、乙霉威、噁醚唑、甲嘧啶醇、烯酰吗啉、烯唑醇、清螨普、二苯胺、吡菌硫、灭菌磷、二嗪农、多果定、脲菌酮、克菌散、氟环唑、乙嘧啶、氯唑灵、双氯苯嘧啶、苯氧唑、吡菌胺、种衣酯、拌种咯、苯锈啶、丁苯吗啉、乙酸三苯基锡、三苯羟基锡、福美铁、噻菌胺、

- 5 氣啉胺、咯菌清、氣氯菌核利、氣噻唑、氣硅唑、噻菌胺、氣酰胺、
 粉唑醇、滅菌丹、乙磷鋁、乙磷鈉、四氯苯酞、麥穗寧、呋霜靈、拌
 種胺、雙胍辛、六氯苯、己唑醇、甲羥異噁唑、抑霉唑、酰胺唑、雙
 10 胍辛醋酸盐、異稻瘟淨、異菌脲、稻瘟靈、春日霉素、銅制剂(如氫
 氧化銅、環烷酸銅、碱式氯化銅、硫酸銅、氧化銅、噻啉酮和波尔多
 混合物)、雙代混剂、代森錳鋅、代森錳、噻菌胺、滅锈胺、甲霜靈、
 葉菌唑、噻菌威、担菌胺、代森聯、噻菌胺、腈菌唑、福美錳、異丙
 消、氣苯噻啉醇、甲呋酰胺、噁酰胺、oxamocarb、氧化萎锈靈、稻
 15 瘟酯、戊菌唑、戊菌隆、稻病磷、稻瘟酞、匹馬菌素、啉啉寧、多氧
 霉素、烯丙異噻唑、咪鮮安、二甲菌核利、霜霉威、丙環唑、甲基代
 森鋅、定菌磷、啉斑脛、噻霉胺、咯噻酮、五氯硝基苯、硫磺和硫制
 剂、戊唑醇、酞枯酸、四氯硝基苯、氣醚唑、噻菌靈、噻菌腈、甲基
 托布津、福美雙、甲基立枯靈、對甲抑菌靈、三唑酮、三唑醇、唑菌
 嗪、楊菌胺、三環唑、環嗎啉、氣菌唑、噻氣靈、滅菌唑、稻紋散、
 15 乙炔菌核利、代森鋅、福美鋅。

杀细菌剂:

拌棉酚、防霉酚、氣定、福美錳、春日霉素、異噻菌酮、呋喃羧
 酸、土霉素、烯丙異噻唑、鏈霉素、酞枯酸、硫酸銅和其它銅制剂。

杀虫剂 / 杀螨剂 / 杀线虫剂:

- 20 齊墩蠟素、虫蟊腈、乙酰甲胺磷、氣酯菊酯、棉鈴威、涕滅威、
 甲体氣氣菊酯、雙甲脒、阿維菌素(avermectin)、AZ 60541、印楝素、
 乙基谷硫磷、谷硫磷、三唑錫、蘇芸金杆菌、苯噁威、丙硫克百威、
 杀虫磺、乙体氣氣氣菊酯、聯苯菊酯、丁苯威、溴醚菊酯
 (brofenprox)、溴硫磷、混戊威、噻嗪酮、丁酮威、丁基吡蟊酮、硫
 25 线磷、西維因、克百威、三硫磷、丁硫克百威、巴丹、CGA 157 419、
 CGA 184 699、除线威、氣氧磷、毒虫畏、定虫隆、氣甲硫磷、毒死
 蟬、甲基毒死蟬、順式苜呋菊酯、三氣氣氣菊酯、四蟊嗪、杀螟腈、
 乙氣菊酯、氣氣氣菊酯、氣氣氣菊酯、三環錫、氣氣菊酯、滅蠅胺、
 溴氣菊酯、甲基內吸磷、內吸磷、異吸磷Ⅱ、杀蟊隆、地亞农、氣线
 30 磷、敌敌畏、dicliphos、百治磷、乙硫磷、伏虫脲、乐果、甲基毒
 虫畏、二噁硫磷、乙拌磷、克瘟散、emamectin、高氣戊菊酯、除蚜
 威、乙硫磷、醚菊酯、丙线磷、乙噻硫磷、克线磷、噻蟊醚、蟊完錫、

杀螟硫磷、仲丁威、苯硫威、双氧威、甲氧菊酯、fenpyrad、唑螨酯、倍硫磷、氟戊菊酯、氟虫腈、氟啶胺、氟螨脲、氟氰戊菊酯、氟虫脲、氟醚菊酯(flufenprox)、氟胺菊酯、地虫硫磷、安果、噻唑硫磷、溴醚菊酯(fubfenprox)、呋线威、六六六、庚虫磷、氟铃脲、噻螨酮、吡虫啉、异稻瘟净、氯唑磷、异丙胺磷、异丙威、噁唑磷、伊维菌素、λ-三氟氯菊酯、虱螨脲、马拉硫磷、灭蚜硫磷、速灭磷、倍硫磷亚砷、蜗牛敌、虫螨畏、甲胺磷、甲噻硫磷、甲硫威、灭多威、速灭威、米尔倍菌素、久效磷、moxidectin、二溴磷、NC 184、啉虫脒、烯啶虫胺、氧乐果、草膦威、砒吸硫磷、异砒磷、对砒磷、甲基对砒磷、氯菊酯、稻丰散、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、抗蚜威、甲基嘧啶硫磷、嘧啶硫磷、丙溴磷、甲丙威、丙虫威、残杀威、低毒硫磷、发果、pymetrozin、吡啶硫磷、苯吡啶硫磷、反灭菊酯、除虫菊酯、哒螨酮、嘧螨醚、蚊蝇醚、啮硫磷、RH 5992、水杨硫磷、硫线磷、氟硅菊酯、治螟磷、甲丙硫磷、虫酰肼、吡螨胺、特丁嘧啶硫磷、伏虫隆、七氟菊酯、双硫磷、叔丁威、特丁甲拌磷、杀虫畏、thiafenox、硫双灭多威、己酮膦威、甲基乙拌磷、啮线磷、苏芸金菌素、四溴菊酯、苯赛螨、三唑磷、triazuron、敌百虫、杀虫隆、三叉威、完灭硫磷、二甲威、二甲苯威、YI 5301/5302、zetamethrin.

20 除草剂:

例如酰胺类如吡氟草胺和敌稗; 芳基羧酸类如二氯吡啶甲酸、麦草畏和毒草定; 芳氧羧酸类如 2,4-滴、2,4-滴丁酸、2,4-滴丙酸、氟草烟、2 甲 4 氯、2 甲 4 氯丙酸和绿草定; 芳氧基苯氧羧酸类如禾草灵、噁唑禾草灵、吡氟禾草灵、吡氟氯禾灵和啮禾灵; 吡啶酮类如杀草敏和啮草伏; 氨基甲酸酯类如氟苯胺灵、甜菜安、甜菜宁和苯胺灵; 氯乙酰苯胺类如甲草胺、乙草胺、丁草胺、吡草胺、异丙草胺、丙草胺和毒草胺; 二硝基苯胺类如安磺灵、二甲戊乐灵和氟乐灵; 二苯醚类如三氟羧草醚、甲羧除草醚、乙羧氟草醚、氟黄胺草醚、halosafen、乳氟禾草灵和乙氧氟草醚; 脲类如绿麦隆、敌草隆、伏草隆、异丙隆、利谷隆和甲基苯噻隆; 羧胺类如禾草灭、烯草酮、噻草酮、稀禾定和膦草酮; 咪唑啉酮类如咪草烟、咪草酯、灭草烟和灭草啮; 腈类如溴苯腈、敌草腈和碘苯腈; 氧乙酰胺类如苯噻草胺; 磺

5 酰脲类如酰嘧磺隆、苄嘧磺隆、氯嘧磺隆、绿磺隆、醚磺隆、甲磺隆、烟嘧磺隆、氟嘧磺隆、吡嘧磺隆、噻磺隆、醚苯磺隆和苯磺隆；硫代氨基甲酸酯类如丁草特、灭草特、燕麦敌、茵达灭、禾草畏、草达灭、苄草丹、杀草丹和野麦畏；三嗪类如莠去津、氟草津、西玛津、西草净、特丁净和特丁津；三嗪酮类如环嗪酮、苯嗪草酮和嗪草酮；其它除草剂如杀草强、吡草黄、灭草松、环庚草醚、异噁草酮、二氯吡啶酸、双苯唑快、氟硫草定、乙吡草黄、氟咯草酮、草铵膦、草甘膦、异亚砷草胺、吡草特、二氯喹啉酸、喹草酸、草硫膦和灭草环。

10 此外，本发明活性化合物可以以其商业上可行的制剂和以由这些制剂制备的使用形式与增效剂的混合物存在。增效剂是可以增加活性化合物活性，而所添加的增效剂本身无需有活性的化合物。

15 由商业上可行的制剂制备的使用形式中的活性化合物的含量可以在相当宽的范围内变化。使用形式的活性化合物浓度可以是按重量计 0.0000001 至 95% 的活性化合物，优选在按重量计 0.0001 至 1% 间。

化合物是以适合于使用形式的常规方式使用的。

当用来防治卫生害虫和贮藏产品的害虫时，活性化合物对木材和陶土具有显著残留作用和对石灰处理过的底物上的碱具有良好的稳定性。

20 本发明活性化合物不仅对植物、卫生和贮藏产品害虫有活性，而且在兽医方面，对动物寄生虫(体外寄生虫)如硬蜱、隐喙蜱科、疥螨、恙螨、(叮咬和吸吮)蝇、寄生蝇幼虫、毛虱、鸟虱和蚤有活性。这些寄生虫包括：

25 虱目，例如，血虱属(*Haematopinus* spp.)、顎虱属(*Linognathus* spp.)、虱属(*Pediculus* spp.)、阴虱属(*Phthirus* spp.)、盲虱属(*Solenoptes* spp.)。

30 食毛目及 amblycerina 和细角亚目(*Ischnocerina*)，例如，毛鸟虱属(*Trimenopon* spp.)、短角鸟虱属(*Menopon* spp.)、豆虱属(*Trinoton* spp.)、牛羽虱属(*Bovicola* spp.)、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、畜虱属(*Damalinae* spp.)、啮毛虱属(*Trichodectes* spp.)和猫虱属(*Felicola* spp.)。

双翅目及长角亚目和短角亚目，例如，伊蚊属(*Aedes* spp.)、

- 按蚊属(*Anopheles* spp.)、库蚊属(*Culex* spp.)、蚋属(*Simulium* spp.)、真蚋属(*Eusimulium* spp.)、白蛉属(*Phlebotomus* spp.)、卢蚊属(*Lutzomyia* spp.)、库蠅属(*Culicoides* spp.)、斑虻属(*Chrysops* spp.)、瘤虻属(*Hybomitra* spp.)、黄虻属(*Atylotus* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、麻虻属(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* spp.、*Braula* spp.、蝇属(*Musca* spp.)、齿股蝇(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属(*Stomoxys* spp.)、血蝇属(*Haematobia* spp.)、*Morellia* spp.、厕蝇属(*Fannia* spp.)、舌蝇属(*Glossina* spp.)、丽蝇属(*Calliphora* spp.)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、金蝇属(*Chrysomyia* spp.)、肉蝇属(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属(*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属(*Gastrophilus* spp.)、虱蝇属(*Hippobosca* spp.)、婢蝇属(*lipoptena* spp.)和羊虱蝇属(*Melophagus* spp.)。
- 15 蚤目，例如，蚤属(*Pulex* spp.)、栉头蚤属(*Ctenocephalides* spp.)、鼠客蚤属(*Xenopsylla* spp.)和毛列蚤属(*Ceratophyllus* spp.)。
- 半翅目，例如，臭虫属(*Cimex* spp.)、锥蝽属(*Triatoma* spp.)、红腹猎蝽属(*Rhodnius* spp.)和全圆蝽属(*Panstrongylus* spp.)。
- 20 蜚蠊目，例如，东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)和棕带蠊属(*Suppella* spp.)。
- 螨亚纲及后气亚目(*Metastigmata*)和中气亚目(*mesostigmata*)，例如，隐喙蜱属(*Argas* spp.)、钝喙蜱属(*Ornithodoros* spp.)、残喙蜱属(*Otobius* spp.)、硬蜱属(*Ixodes* spp.)、花蜱属(*Amblyomma* spp.)、牛蜱属(*Boophilus* spp.)、革蜱属(*Dermacentor* spp.)、血蜱属(*Haemaphysalis* spp.)、眼玻蜱属(*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.)、刺皮螨属(*Dermanyssus* spp.)、刺利螨属(*Raillietia* spp.)、肺刺螨属(*Pneumonyssus* spp.)、胸口螨属(*Sternostoma* spp.)和瓦螨属(*Varroa* spp.)。
- 30

Actinedida(前气孔亚目)和粉螨目(无气孔亚目),例如,蜂盾螨属(*Acarapis* spp.)、姬螯螨属(*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属(*Ornithocheyletia* spp.)、肉螨属(*Myobia* spp.)、疮螨属(*Psorergates* spp.)、蠕形属(*Demodex* spp.)、恙螨属(*Trombicula* spp.)、托螨属(*Listrophorus* spp.)、粉螨属(*Acarus* spp.)、食酪螨属(*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属(*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属(*Hypodectes* spp.)、翅螨属(*Pterolichus* spp.)、瘡螨属(*Psoroptes* spp.)、痒螨属(*Chorioptes* spp.)、耳癢螨属(*Otodectes* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、痂螨属(*Notoedres* spp.)、疣螨属(*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属(*Cytodites* spp.)和皮膜螨属(*Laminosioptes* spp.).

本发明式(I)活性化合物也适合防治侵害如下动物的节肢动物:牲畜例如牛、绵羊、山羊、马、猪、猴、骆驼、水牛、兔、鸡、火鸡、鸭、鹅、蜜蜂,其它家养动物,如狗、猫、笼养鸟、水箱中的鱼,和所谓的实验动物,例如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过防治这些节肢动物,旨在使死亡和产量(如肉、乳、毛、皮、蛋、蜜等)降低的情况减少。这样,通过使用本发明活性化合物,使更经济简单的动物管理成为可能。

本发明活性化合物可以使用在兽医方面,使用是以已知的方式,通过外部施用,例如以片剂、胶囊、药水、兽用顿服剂、颗粒剂、膏剂、大丸剂、食入法、栓剂的方式,通过非肠道施药,例如注射(肌内、皮下、静脉内、腹腔内等)、植入,经鼻施用,经皮施用,例如通过沐浴或浸蘸、喷雾、浇泼、点涂、洗刷、喷粉的方式,以及借助含有活性化合物的成形物件,如颈环、耳标、尾牌、腿箍、笼头、标记设备等。

当给药于畜禽、家养动物等时,式(I)的活性化合物可以以制剂的形式(例如粉剂、乳剂、悬浮剂)的使用,所述的制剂中含有按重量计1至80%的活性化合物,该制剂可以直接施用或稀释100至10000倍后施用,或者它们可以以化学浴的形式使用。

然而,现已发现,本发明式(I)化合物对破坏工业材料的昆虫具有强的杀虫作用。

可以列举且是优选的昆虫是下列，但不限于这些昆虫：

甲虫如

北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、长毛天牛(*Chlorophorus pilosis*)、具斑窃蠹(*Anobium punctatum*)、报死窃蠹(*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹(*Ptilinus pecticornis*)、
5 *Dendrobium pertinex*、松窃蠹(*Ernobium mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹(*Lyctus africanus*)、南方粉蠹(*Lyctus planicollis*)、桉粉蠹(*Lyctus linesris*)、柔毛粉蠹(*Lyctus pubescens*)、*Trogoxylon aequale*、
10 鳞毛粉蠹(*Minthes rugicollis*)、材小蠹(*Xyleborus spec.*)、*Tryptodendron spec.*、咖啡黑长蠹(*Apate monachus*)、榭长蠹(*Bostyrchus capucins*)、暗褐长蠹(*Heterobostrychus brunneus*)、长蠹属(*Sinoxylon spec.*)和竹长蠹(*Dinoderus minutus*)。

15 革翅目，如

小钢青树蜂(*Sirex juvencus*)、大树蜂(*Urocerus gigas*)、
U. gigas taignus、*U. augur*。

白蚁，如

木白蚁(*Kaloterms flavicollis*)、麻头堆砂白蚁
20 (*Cryptoterms brevis*)、灰点异白蚁(*Heteroterms indicola*)、黄胸散白蚁(*Reticulitermes flavipes*)、
Reticulitermes santonecsis、避光散白蚁(*Reticulitermes lucifugus*)、达尔文澳白蚁(*Mastoterms darwiniensis*)、湿木白
蚁(*Zootermopsis nevadensis*)和家白蚁(*Coptoterms*
25 *formosanus*)。

衣鱼

如西洋衣鱼(*Lepisma saccharina*)。

在本文中，工业材料应理解为无生命的材料如优选的是聚合物、
胶水、粘性材料、纸和板、皮革、木材和木制品和漆。

30 木材和木制品是非常特别优选的受保护而使之不被昆虫侵害的
材料。

可以用本发明的药剂或含有之的组合物保护的木材和衍生的木

制品应理解为有下列含意，例如，建筑木料、木梁、铁道枕木、桥梁组件、船用跳板、木制车辆、板箱、模板、包装箱、电线杆、木质矿道顶木、木制的门窗、胶合板、碎料板、木工的制品、或通常用在建筑或细木工中的木制品。

5 本发明活性化合物可以以其原样、以其浓缩物或通常的常规制剂使用。所述的常规制剂是例如可湿性粉剂、颗粒剂、溶液、悬浮剂、乳剂或膏剂。

上述制剂可以以本身已知的方式制备，例如通过将活性化合物与至少一种溶剂或稀释剂、乳化剂、分散剂和/或粘合剂或固定剂、防水剂、(如果需要)脱水剂和 UV 稳定剂和(如果需要)着色剂和染料和其它加工辅助剂混合。

用于保护木材和木制品的杀虫组合物或浓缩物包含浓度为按重量计 0.0001 至 95%，特别是按重量计 0.001 至 60% 的活性化合物。

15 所采用的组合物或浓缩物的量取决于昆虫的种类和密度，以及介质。所用最佳量可以在每种情况下由一系列试验来确定。然而，一般而言，以所要保护的材料为基准，采用按重量计 0.0001 至 20%，优选按重量计 0.001 至 10% 的活性化合物已足矣。

所用的溶剂和/或稀释剂是有机化学溶剂或溶剂混合物和/或低挥发性的油性或油样有机化学溶剂或溶剂混合物和/或极性有机化学溶剂或溶剂混合物和/或水，且如果适宜是乳化剂和/或润湿剂。

25 优选采用的有机化学溶剂是油性或油样溶剂，所述的溶剂具有大于 35 的挥发度和高于 30℃ 的闪点，优选高于 45℃。用作这种油性或油样溶剂的物质是低挥发性的，且不溶于水，这类物质适合的有矿物油或其芳族馏份或是含有矿物油的溶剂混合物，优选是石油溶剂、石油和/或烷基苯。

使用沸程为 170 到 220℃ 的矿物油、沸程为 170 到 220℃ 的石油溶剂、沸程为 250 到 350℃ 的砵子油、沸程为 160 到 280℃ 的石油或松节油精是有利的。

30 在优选的实施方案中，所用的物质是沸程为 180 至 210℃ 的液体脂族烃或沸程为 180 至 220℃ 的脂族和芳族烃的高沸点混合物和/或砵子油和/或单氯萘，优选 α -单氯萘。

挥发度高于 35 且闪点高于 30℃，优选高于 45℃ 的低挥发性有机

油性或油样溶剂，可以部分地由低或中挥发性的有机化学溶剂置换，其前提条件是，溶剂混合物也具有高于 35 的挥发度且闪点高于 30℃，优选高于 45℃，且杀虫剂/杀真菌剂混合物在此溶剂混合物中是可溶的或可乳化的。

- 5 在优选的实施方案中，部分有机化学溶剂或溶剂混合物被脂族极性有机化学溶剂或溶剂混合物置换。优选采用的物质是含有羟基和/或酯和/或醚基团的脂族有机化学溶剂，如例如乙二醇醚、酯类等。

- 10 在本发明范围内使用的有机化学粘合剂是本身已知的粘合干性油和/或合成树脂，它们可以用水稀释和/或在所采用的有机化学溶剂中是可溶的、可分散的或可乳化的，特别是那些由如下组成，或包含如下成分的粘合剂：丙烯酸树脂、乙烯基树脂，例如聚乙酸乙烯酯、聚酯树脂、缩聚或加聚树脂、聚氨酯树脂、醇酸树脂或改性的醇酸树脂、苯酚树脂、烃类树脂如茛-香豆酮树脂、硅氧烷树脂、干性植物油和/或干性油和/或以天然和/或合成树脂为基础的物理干性粘
15 剂。

用作粘合剂合成树脂可以以乳液、分散液或溶液的形式使用。沥青或沥青状物质也可以用作粘合剂的物质，其量至多为按重量计 10%。此外，可以采用特别是着色剂、染料、防水剂、遮味剂和抑制剂或抗腐蚀剂。

- 20 根据本发明，组合物或浓缩物优选含有至少一种醇酸树脂或改性醇酸树脂和/或干性植物油作为粘合剂。根据本发明所优选采用的物质是油含量超过按重量计 45%，优选 50 至 68% 的醇酸树脂。

- 25 所有的或部分上述粘合剂可以由固定剂(混合物)或增塑剂(混合物)置换。这些添加剂是旨在防止活性化合物挥发和结晶或沉淀。它们优选置换 0.01 至 30% 的粘合剂(以所用的粘合剂的 100% 为基准)。

- 30 增塑剂来自属于下列化学类的物质：邻苯二甲酸酯类，如邻苯二甲酸二丁酯、邻苯二甲酸二辛酯或邻苯二甲酸苄基丁基酯，磷酸酯类，如磷酸三丁酯，己二酸酯类，如二(2-乙基己基)己二酸酯，硬脂酸酯，如硬脂酸丁酯或硬脂酸戊酯，油酸酯类，如油酸丁酯，甘油醚类或高分子量乙二醇醚类、甘油酯类和对甲苯磺酸酯类。

固定剂化学上基于聚乙烯烷基醚类如聚乙烯甲基醚，或酮类如二

苯甲酮或亚乙基二苯甲酮。

特别适合的溶剂或稀释剂也可以是水，如果适宜是水与一或多种上述有机化学溶剂或稀释剂、乳化剂和分散剂的混合物。

特别有效的木材保护通过工业规模的浸渍工艺，例如真空、双真空或压力工艺的方式获得。

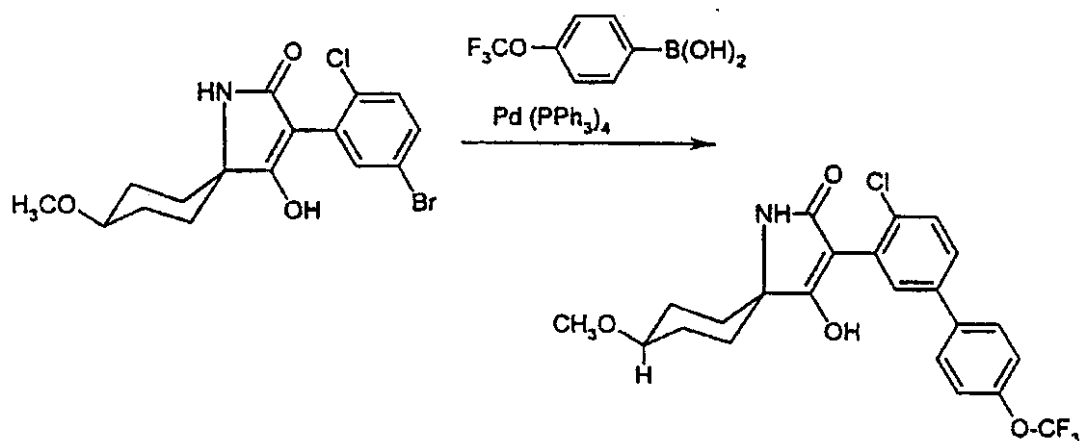
如果适宜，直接可用的组合物还可以包含其它杀虫剂和(如果适宜)也可以有一或多种杀真菌剂。

可能混合于其中的另外的适合组分优选是 WO 94/29 268 中提到的杀虫剂和杀真菌剂。在上述文献中提到的化合物明确地说是本发明申请的一部分。

可以非常特别优选地混合于其中的组分是杀虫剂如毒死蜱、辛硫磷、氟硅菊酯、氟氯菊酯、甲体氯菊酯、氯菊酯、溴氯菊酯、氯菊酯、吡虫啉、啉虫脒、氟虫脲、氟铃脲和杀虫隆，以及杀真菌剂如氟环唑、己唑醇、戊环醇、丙环唑、戊唑醇、环唑醇、叶菌唑、抑霉唑、苯氧磺胺、甲苯氧磺胺、3-碘代-2-丙炔基丁基氨基甲酸酯、N-辛基-异噻唑啉-3-酮和 4,5-二氯-N-辛基异噻唑啉-3-酮。

本发明活性化合物的制备和应用通过参见下列实施例说明。

实施例 (I-1a-1)



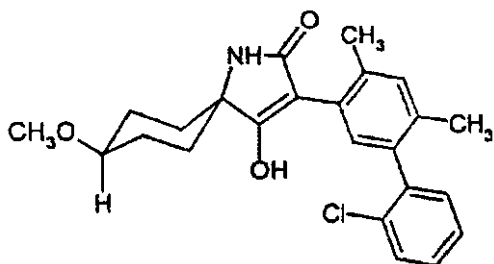
将 1.93g 上述溴化合物在 20ml 1,2-二甲氧基乙烷中在 20℃ 与 1.6g 4-三氟甲氧基苯基硼酸和 0.92g 四(三苯基膦)钯混合，将混合物在 20℃ 下搅拌 15 分钟，进入 15ml 20% 的碳酸钠溶液并在 80℃ 下搅拌一天。将溶液过滤，用乙酸乙酯萃取。水相在 0-10℃ 下用浓盐酸

酸化，真空下浓缩至干，残余物用二氯甲烷/乙酸乙酯 3:1 为移动相进行硅胶层析。

产量 0.40g (理论量的 17%), m. p. 143℃.

实施例 (I-1a-14)

5



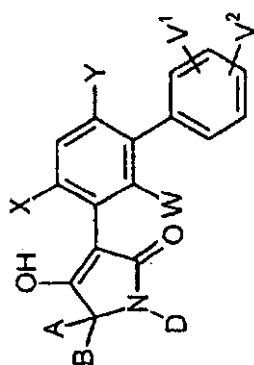
在 80℃ 向在 7ml 无水二甲基甲酰胺中的 2.6g 叔丁醇钾中滴加在 9ml 无水 DMF 中的 4.42g 实施例 (II-10) 的化合物，并在此温度下搅拌直到反应结束 (用薄层层析监测)。冷却后，加入 90ml 冰水，在 0-10℃ 下用浓盐酸酸化至 pH2。吸滤，用冰水洗涤，干燥并与甲基叔丁基醚 (MTBE) / 正己烷一起煮沸。

10

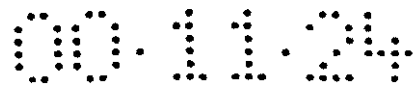
产量 2.81g (理论量的 68%), m. p. 204℃.

通过实施例 I-1-a-1 和 I-1-a-14 并通过制备式 I-1-a 化合物的一般描述，制备下列化合物：

15



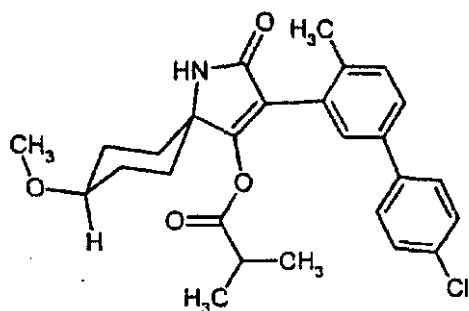
实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	m.p. (°C)	异构体
I-1-a-2*	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-3*	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-4*	CH ₃	OCH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-5*	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-6*	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-7*	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>250	-
I-1-a-8*	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>240	-
I-1-a-9*	H	Cl	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CH-OCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-10*	H	Cl	H	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-11*	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-12*	H	Cl	OCH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-13*	H	Cl	OCH ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		134	β



式I-a化合物表格 (续)

实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	m.p. (°C)	异构体
I-1-a-14	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		204	β
I-1-a-15	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		156	-
I-1-a-16*	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		185	β
I-1-a-17	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		>245	β
I-1-a-18	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₃	CH ₃	222	-
I-1-a-19	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		185	β
I-1-a-20	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>250	-
I-1-a-21	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>240	-
I-1-a-22	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>240	-
I-1-a-23	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		208	β
I-1-a-24	H	C ₂ H ₅	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		138	β
I-1-a-25	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		238	β
I-1-a-26	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>250	-
I-1-a-27	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>235	-

*通过实施例I-1-a-1方法经由Suzuki偶联制备

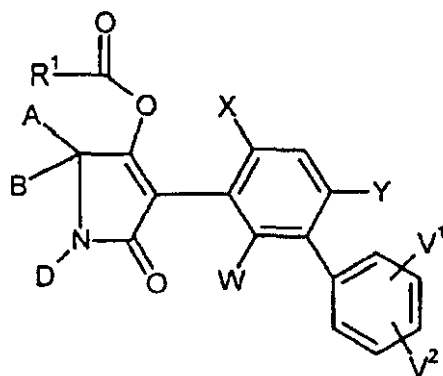
实施例 I-1-b-1

在回流下, 将 0.4ml 异丁酰氯加入到在 30ml 乙酸乙酯(EA)中的
5 1g 实施例(I-1-a-16)化合物和 0.5ml 三乙胺中, 并将混合物搅拌直到反应结束(用 TLC 监视)。将混合物浓缩并通过硅胶色谱纯化。

移动相: 二氯甲烷/EA 10/1

产量: 0.15g (理论量的 11%), m. p. 201℃.

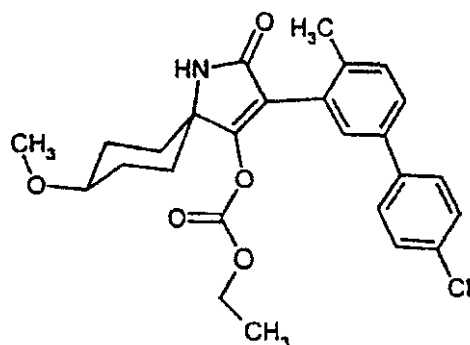
通过实施例(I-1-b-1)方法和制备式(I-1-b)化合物的一般方
10 法, 制备下列化合物:



(I-1-b)

实施例 序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	R ¹	m.p. (°C)	异构体
I-1- b-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	>230	β

实施例 I-1-c-1



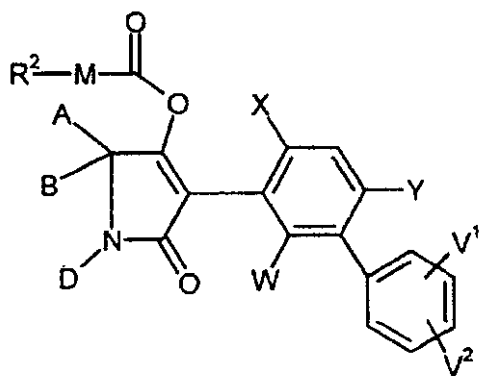
在 0℃ 下，将 0.35g 氯甲酸乙酯加入在 30ml 二氯甲烷中的 1g 实施例 (I-1-a-16) 化合物和 0.5ml 三乙胺中，并将混合物在 20℃ 下搅拌一天。将混合物浓缩，并将残余物通过硅胶色谱纯化。

移动相：二氯甲烷/EA 10/1

产量：0.12g, m. p. 194℃.

通过实施例 (I-1-c-1) 方法，并根据制备式 (I-1-c) 化合物的一般方法，制备下列化合物

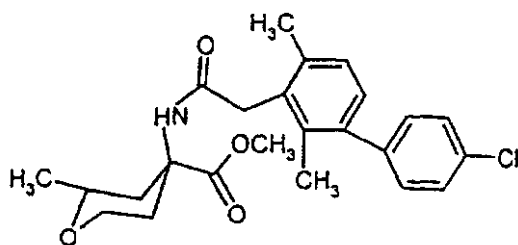
10



(I-1-c)

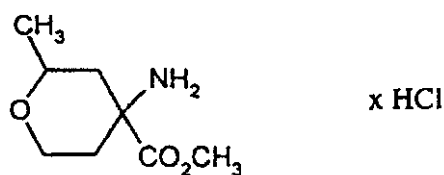
实施例 序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	M	R ²	m.p. (°C)	异构体
I-1- c-2	H	CH ₃	H	Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	187	β
I-1- c-3	H	CH ₃	H	Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	>240	-
I-1- c-4	H	CH ₃	H	Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	i-C ₄ H ₉	168	β
I-1- c-5	H	CH ₃	H	Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	149	-

实施例 II-1



- 5 将 5g 实施例 (XXVII-5) 化合物和 7.6ml 亚硫酸氯在 80℃ 下加热, 直至不在产生气体。去除过量的亚硫酸氯, 并将残余物用 20ml 乙腈消化(溶液 1)。

先将 4.61g 下式化合物

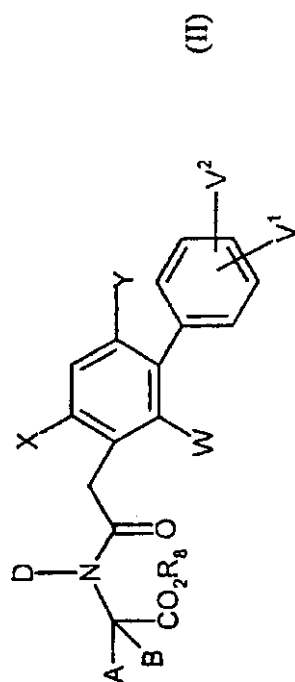


10

加入到 20ml 乙腈中, 加入 6.1g 磨碎的碳酸钾, 在 0-10℃ 下滴加入溶液 1, 并将混合物在室温下搅拌 1 小时。将混合物倒入 250ml 冰水中, 并用二氯甲烷萃取, 并将萃取液用 0.5N HCl 洗涤并浓缩。残余物经硅胶色谱(移动相为二氯甲烷/EA 3/1), 产量 5g, m. p.: 91℃。

15

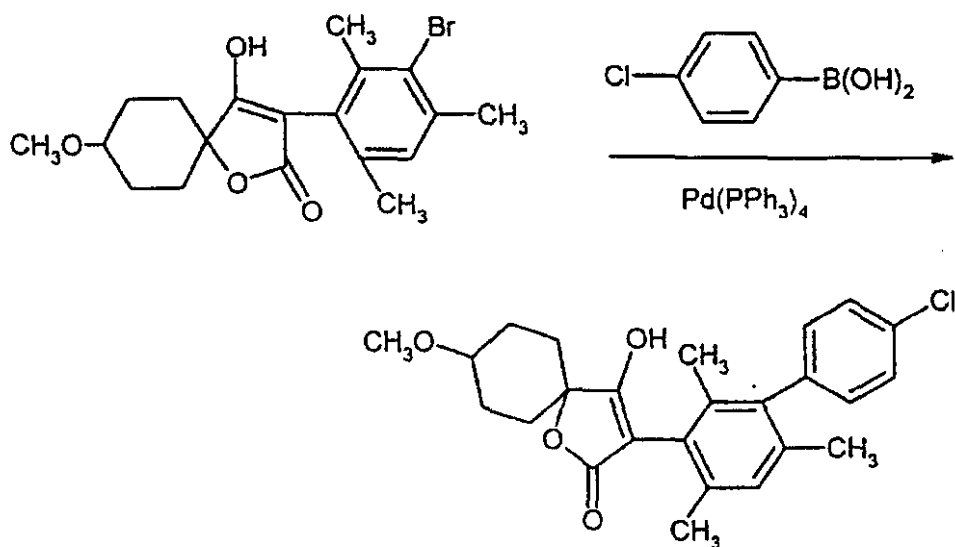
通过实施例 II-1 的方法, 并根据制备式 (II) 化合物的一般程序, 获得下列式 (II) 的实施例



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	R ⁸	m.p. (°C)	异构体
II-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	125	-
II-3	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	76	β
II-4	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	179	-
II-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	186	β
II-6	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	169	-
II-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	194	β
II-8	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	123	-
II-9	H	C ₂ H ₅	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	109	β
II-10	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	121	β

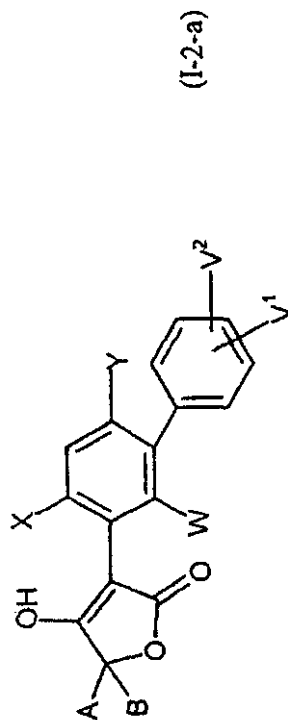
式 (II) 化合物的表格 (续)

实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	D	A	B	R ⁸	m.p. (°C)	异构体
II-11	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	165	-
II-12	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	139	β
II-13	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	185	-
II-14	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	145	β
II-15	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	154	-
II-16	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	76	β
II-17	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	137	-
II-18	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	166	-

实施例 (I-2-a-1)

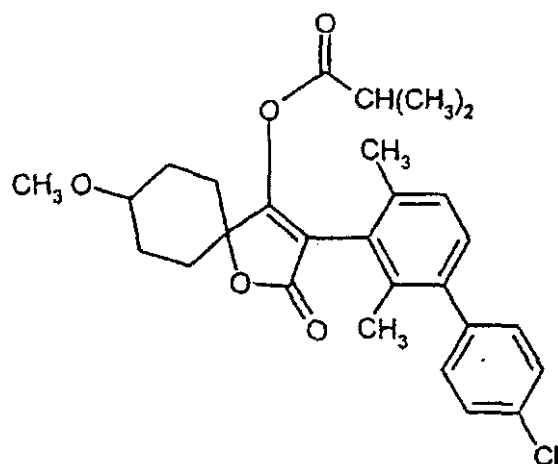
5 将 19.5ml 浓度 20% 的碳酸钠溶液加入到 20ml 二甲氧基乙烷中的 W0 97/36868 实施例获得的 1.55g 上述溴化合物、0.73g 4-氯苯基硼酸和 0.27g 四(三苯基膦)钯, 并将混合物在 80℃ 下搅拌 4 小时. 混合物用 1N NaOH 混合, 并用乙醚萃取二次. 将碱相过滤, 并使用稀盐酸酸化. 将混合物抽吸过滤并干燥. 产量 0.36g, m. p. 260-263℃.

10 通过实施例 I-2-a-1 的方法, 并根据制备式 (I-2-a) 化合物的程序, 获得下列式 (I-2-a) 的实施例.



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	m.p. (°C)
I-2-a-2	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		243-245
I-2-a-3	H	Cl	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	1)	

1) ¹H NMR (300 MHz, d₆-DMSO): δ = 3.27, 3.29 (2s, 3H, OCH₃), 7.51-7.71 (m, 7H, ArH) 12.6 (brd, 1H, OH).

实施例 I-2-b-1

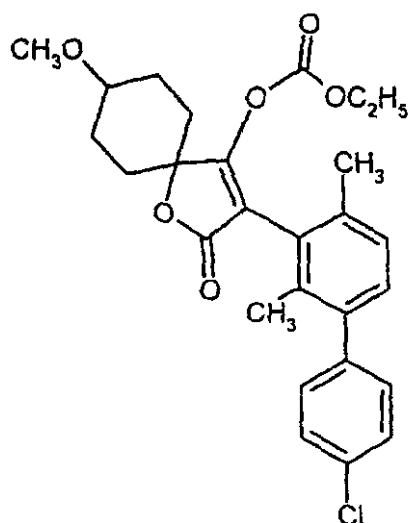
5 先将 0.125g (0.3mmol) 化合物 I-2-a-2 加入到无水二氯甲烷中，之后与 0.04g (0.36mmol) 三乙胺混合，并在 0-10℃ 下滴加入 0.04g (0.36mmol) 异丁酰氯。将混合物搅拌过夜，随后用浓度 10% 的柠檬酸洗涤一次，用浓度 10% 的碳酸钠水溶液洗涤一次，并将有机相干燥和浓缩。

产量：0.1g 油。

10

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ = 2.06, 2.07 (2s, 3H, Ar CH_3), 2.24, 2.25 (2s, 3H, Ar CH_3), 2.61 (m, 1H, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$), 3.35, 3.40 (2s, 3H, OCH_3), 7.09 (s, 2H, ArH), 7.16, 7.19 (AA', BB', 1H, Ar-H), 7.35, 7.37 (AA', BB', 2H, ArH).

实施例 I-2-c-1

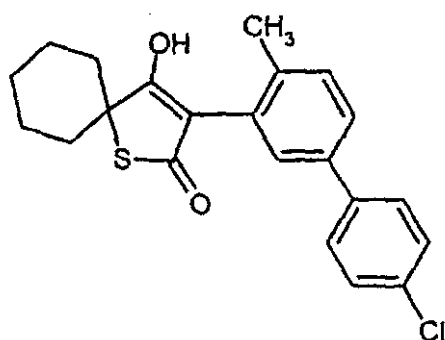


通过实施例 I-2-b-1 的方法，通过使实施例 I-2-a-2 化合物与氯甲酸乙酯反应制备。油。

$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, CDCl_3): δ = 1.10, (t, 3H, $\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_3$), 2.08, (2s, 3H, Ar CH_3), 2.24, 2.25 (2s, 3H, Ar CH_3), 3.36, 3.40 (2s, 3H, OCH_3), 7.11 (2s, 2H, ArH), 7.18, 7.21 (AA', BB', 2H, ArH), 7.35, 7.38 (AA', BB', 2H, ArH).

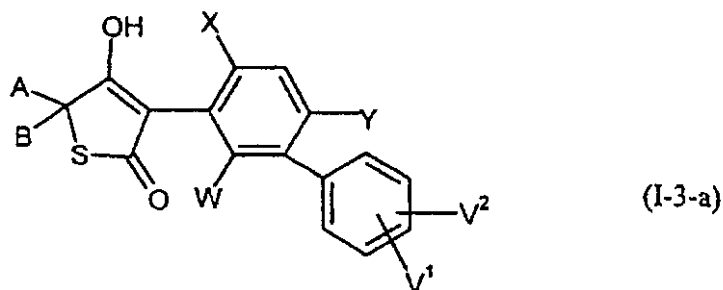
5

实施例 I-3-a-1



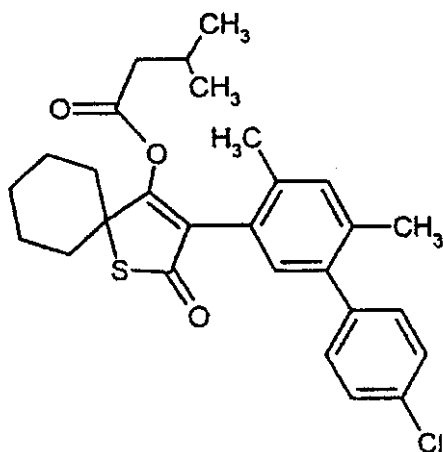
10 将 44g 实施例 IV-1 化合物和 92ml 三氟乙酸在 210ml 甲苯中加热回流过夜。将混合物浓缩，并将残余物用 600ml 水和 200ml MTBE 消化。通过加入 NaOH 将 pH 调节到 14，混合物用 MTBE 萃取二次。水相滴加到 1 升 1N HCl 中。将混合物搅拌 2 小时，用二氯甲烷萃取并浓缩。纯化时，将残余物用大约 200ml MTBE/环己烷 8/1 搅拌，抽吸过滤并干燥。产量：5.9g, m.p. 232-235°C.

通过实施例 (I-3a-1) 的方法和/或根据制备式 (I-3-a) 化合物的一般程序, 获得下列化合物



实施例 序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	m.p. (°C)
I-3-a-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		245-247
I-3-a-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		248-250

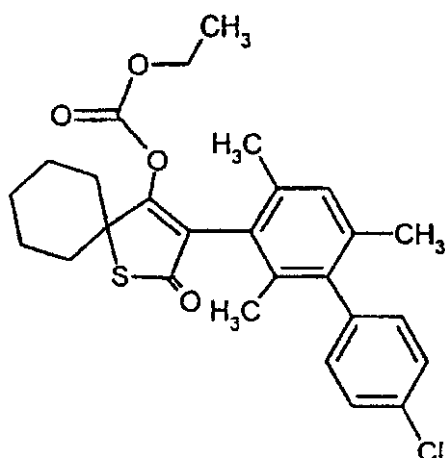
5 实施例 I-3-b-1



通过实施例 I-2-b-1 的方法, 使实施例 I-3-a-2 与异戊酰氯反应而制备。

10

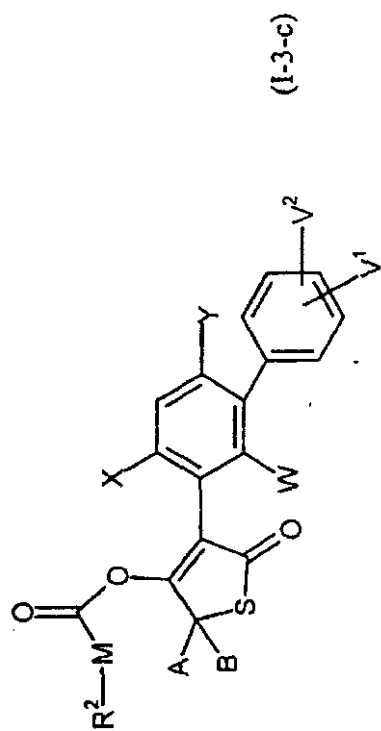
¹H NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ=0.9 (d, 6H, CH-CH₃); 1.2-2.0 (m, 10H, 环己基 -H); 2.1, 2.2 (s, 6H, 2xArCH₃); 6.85-7.5 (m, 6H, ArH) ppm.

实施例 I-3-c-1

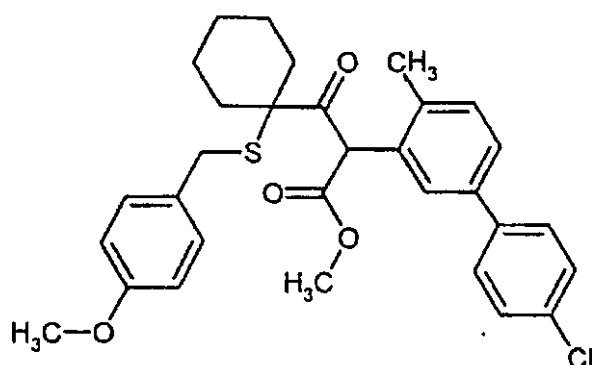
通过实施例 I-2-c-1 的方法，使实施例 I-3-a-3 与氯甲酸乙酯反
5 应而制备。油。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): $\delta=0.95$ (t, 3H, CH_2CH_3); 1.3-1.9 (m, 10H, 环己基 -H); 1.9 (s, 3H, ArCH_3); 2.1 (s, 6H, 2 x Ar-CH_3); 4.0 (q, 2H, OCH_2); 7.0-7.5 (m, 5H, Ar-H) ppm.

通过实施例 (I-3-c-1) 的方法和/或根据制备式 (I-3-c) 化合物的一般程序，获得下列化合物

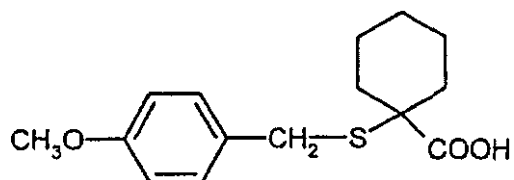


实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	M	R ²	m.p. (°C)
1-3-c-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		O	C ₂ H ₅	油状物

实施例 IV-1

A: 将 15g (53.5mmol) 下式化合物

5



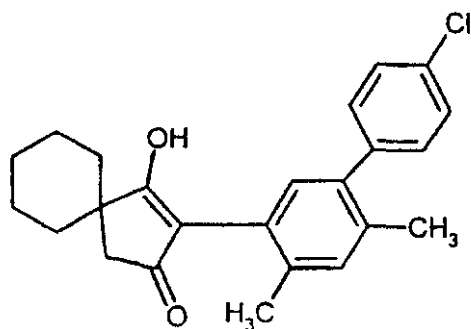
使用 9.63g (80.3mmol) 亚硫酰氯用常规方式转化成相应的酰氯, 并溶解于 30ml 四氢呋喃(THF)中。

10 B: 在 0℃ 下, 将 27g (87.5mmol) 实施例 XXXII-2 化合物滴加入到在 100ml THF 中的 45.8 ml (96.3mmol, 1.1 eq) 二异丙基氨基锂(LDA)溶液中, 将混合物在此温度下搅拌 30 分钟, 将加入上述 A 中制备的溶液。无需冷却, 继续搅拌 1 小时。之后滴加入 300ml MTBE 和几滴水, 混合物用每次 300ml 浓度 10% 的 NH_4Cl 溶液洗涤二次, 并浓缩。产量 44g. 油。

15

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): δ =1.2-2.0 (m, 10H, 环己基 -H); 2.25 (s, 3H, Ar- CH_3); 3.1 (dd, 2H, SCH_2); 3.6-3.7 (s, 6H, 2xOCH $_3$); 6.7-7.7 (m, 12H, Ar-H) ppm.

实施例 I-7-a-1

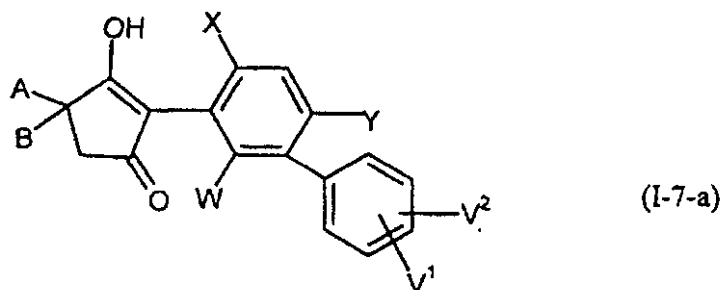


5 先将 5.3g (12.8mmol) 实施例 X-1 化合物加入到 20ml DMF 中, 与 2.2g (19.2mmol, 1.5eq) 叔丁醇钾混合, 并在 80℃ 下加热 1 小时 (用 TLC 监测)。

之后将混合物缓慢加入到大约 0.6 升 1N HCl (在冷却下) 中, 抽吸过滤并干燥。产量 4.85g, m. p. 224-226℃。

通过实施例 (I-7-a-1) 的方法和/或根据制备式 (I-7-a) 化合物的一般程序, 获得下列化合物

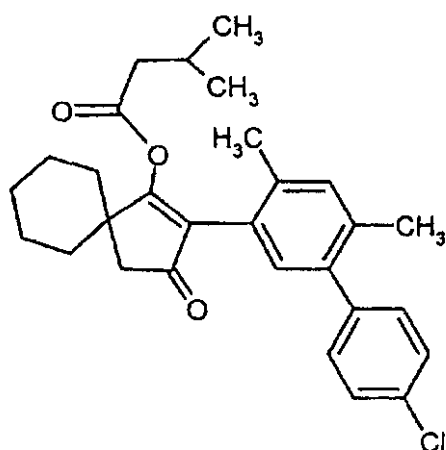
10



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	m.p. (°C)
I-7-a-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		223-224
I-7-a-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		>250

实施例 I-7-b-1

15

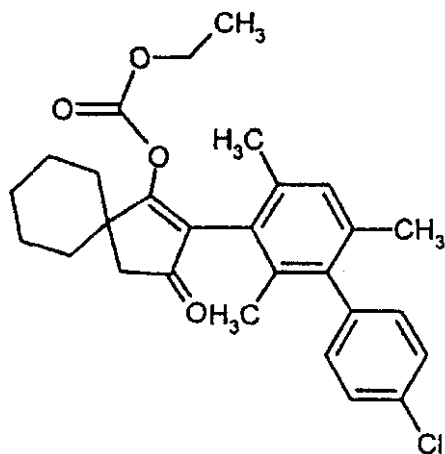


通过实施例(I-2-b-1)的方法,通过使实施例(I-7-a-1)化合物与异戊酰氯反应而制备。产量 1.26g 油。

5

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): $\delta=0.95$ (d, 6H, $2\times\text{CH}-\text{CH}_3$); 1.2-1.8 (m, 10H, 环己基 -H); 2.1, 2.2 (s, 6H, $2\times\text{Ar}-\text{CH}_3$); 6.8-7.5 (m, 6H, Ar-H) ppm.

实施例 I-7-c-1



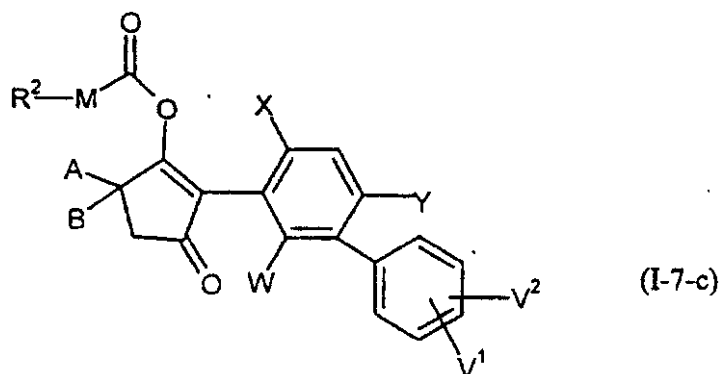
10

通过实施例(I-2-c-1)的方法,通过使实施例(I-7-a-3)化合物与氯甲酸乙酯反应而制备。产量 1.3g. 蜡。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): 1.2 (t, 3H, CH_2CH_3); 1.3-1.8 (m, 10H, 环己基); 1.65, 1.9, 2.05 (s, 3 x 3H, Ar- CH_3); 3.05 (bs, 2H, 环戊基 CH_2); 4.2 (q, 2H, OCH_2); 7.0 - 7.5 (m, 5H, Ar-H).

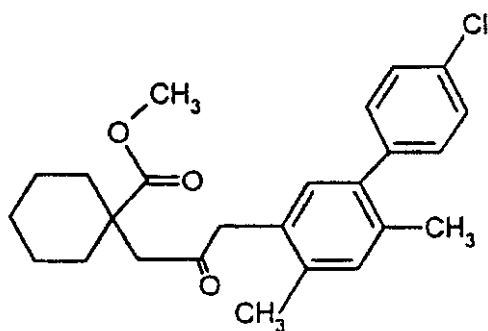
通过实施例 (I-7-c-1) 和/或根据制备式 (I-7-c) 的一般程序, 获得下列化合物

5



实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	M	R ²	m.p. (°C)
I-7-c-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	oil

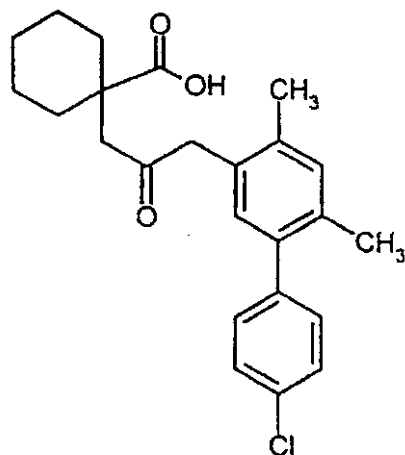
实施例 X-1



- 10 将 24g 实施例 (XXXVIII-1) 化合物的粗制产物在回流下在 140ml 丙酮中与 8.2g 碳酸钾和 25.4g 甲基碘一起加热 16 小时。将混合物过滤, 并浓缩, 残余物经硅胶纯化: 移动相为二氯甲烷/石油醚 2/1, 最终纯的二氯甲烷。产量 5.6g。

^1H NMR (400 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=1.2\text{-}1.8$ (m, 10H, 环己基 H); 2.1, 2.2 (s, 6H, $2\times\text{Ar-CH}_3$); 2.9, 3.8 (s, 4H, $2\times\text{COCH}_2$); 3.5 (s, 3H, OCH_3); 6.95-7.5 (s, 6H, Ar-H) ppm.

实施例 XXXVIII-1

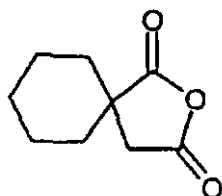


5

在 -15°C 下, 将 17.9g 实施例 XXXII-1 化合物的溶液滴加入 30ml LDA 溶液 (2M, 1.1eq) 在 60ml THF 中的溶液中, 将混合物在 0°C 下搅拌 1 小时。在 -15°C 下, 滴加入 6.1g 实施例 XLI-1 化合物在 10ml THF 中的溶液。混合物在室温下搅拌 2 小时, 加入 100ml 水和 24g 氯化铵, 并将混合物用浓盐酸酸化。中间体用醚萃取。将萃取液浓缩, 残余物与 60g KOH 在 220ml 水中加热 2 天。冷却后, 将混合物用浓盐酸酸化, 并用醚萃取。粗产物作进一步的反应, 无需纯化。产量 24g.

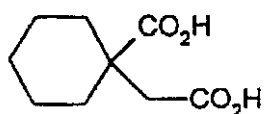
10

实施例 XLI-1



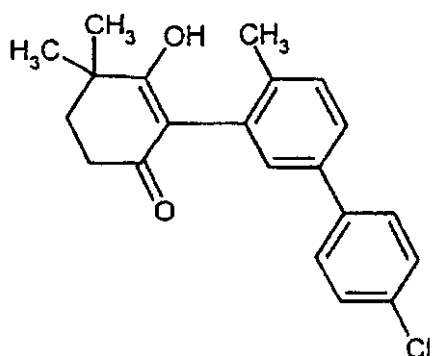
15

将在 500ml 乙酸酐中的 100g 化合物



回流加热。将混合物浓缩，残余物溶解于少量二氯甲烷中，并与正己烷混合。混合物留在冷却装置中过夜，抽吸滤出并干燥。产量 74.8g.

5 实施例 I-8-a-1

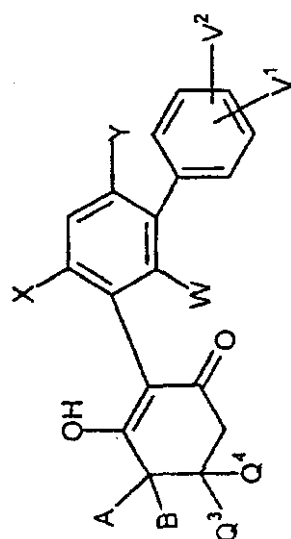


10 将 0.95g 叔丁醇钾加入到在 10ml DMF 中的 2.1g 实施例 (XI-1) 化合物中，并将此混合物在 80℃ 下加热 2 小时。用冰冷却，将混合物缓慢加入到大约 1 升 1N HCl 中，并抽吸滤出沉淀物。

产量 0.2g

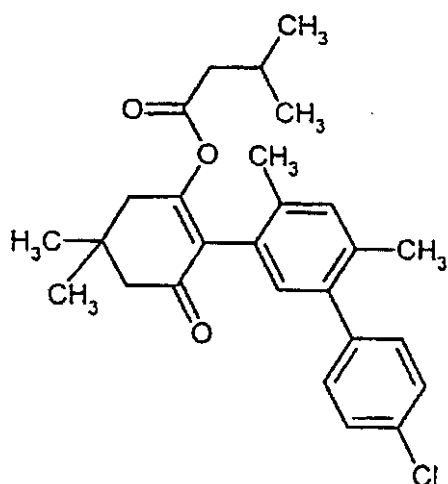
^1H NMR, (400 MHz, d_6 -DMSO): δ =1.1 (s, 6H, C-CH₃); 1.85 (m, 2H, COCH₂CH₂); 2.0 (s, 3H, ArCH₃); 2.65 (m, 2H, COCH₂CH₂); 7.1-7.6 (m, 7H, Ar-H) ppm.

15 通过实施例 (I-8-a-1) 的方法，和/或根据制备式 (I-8-a) 化合物的一般程序，获得下列化合物



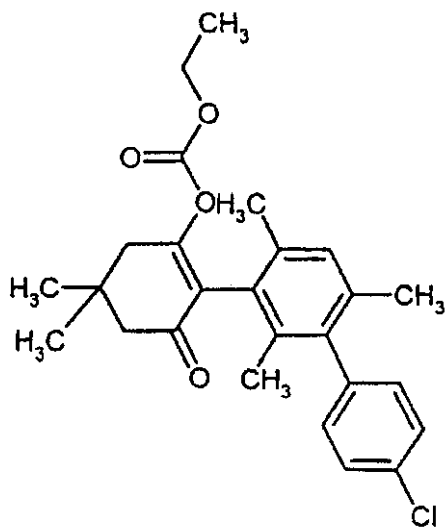
(1-8-a)

实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Q ³	Q ⁴	m.p. (°C)
1-8-a-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	223-225
1-8-a-3	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	树脂
1-8-a-4	H	CH ₃	H	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	树脂
1-8-a-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	>250

实施例 I-8-b-1

通过实施例 (I-2-b-1) 的方法, 通过使实施例 (I-8-a-2) 化合物与
5 异戊酰氯反应而制备。油。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): 1.1 (δ , 6H, $2\times\text{CHCH}_3$); 1.1 (s, 6H, $2\times\text{CCH}_3$); 1.65 (m, 1H, CHCH_3); 2.0, 2.2 (s, 6H, ArCH₃); 6.7-7.5 (m, 6H, Ar-H) ppm.

实施例 I-8-c-1

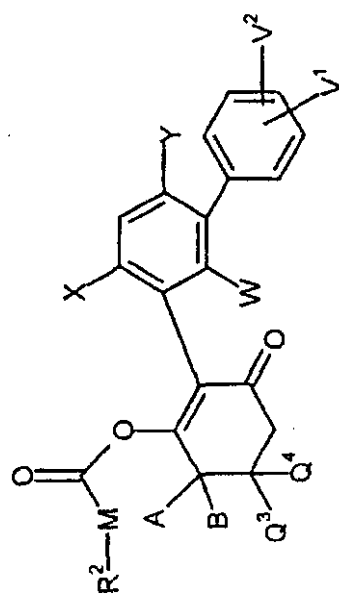
10

通过实施例 (I-2-c-1) 的方法, 通过使实施例 (I-8-a-5) 化合物与

氯甲酸乙酯反应而制备。

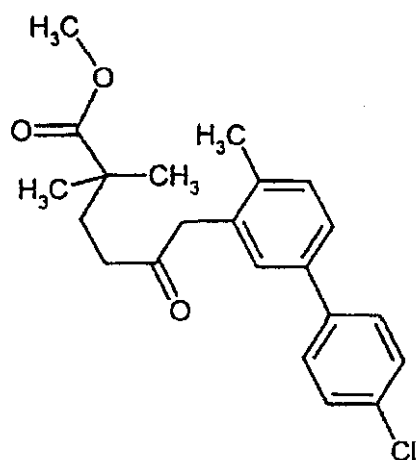
^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): δ =1.1 (t, 3H, CH_2CH_3); 1.14 1.18 (s, 2x3H, C- CH_3);
1.9 2.0 2.1 (s, 3x3H, Ar CH_3); 2.45 2.7 (d, 2x2H, 环己基 - CH_2); 4.1 (q, 2H, OCH_2);
7.0 - 7.5 (m, 5H, Ar-H) ppm.

通过实施例 (I-8-c-1) 的方法, 和/或根据制备式 (I-8-c) 化合物
5 的一般程序, 获得下列化合物



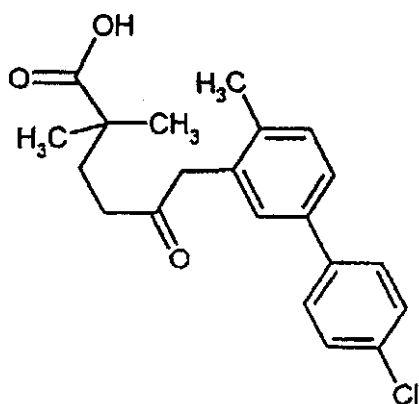
(I-8-c)

实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	A	B	Q ³	Q ⁴	M	R ²	m.p. (°C)
1-8-c-2	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	油状物

实施例 XI-1

5 将 38.2g 实施例 XLII-1 化合物、14.6g 碳酸钾和 45.25g 甲基碘在 250ml 丙酮中加热回流 16 小时。将混合物过滤，并浓缩，残余物经硅胶纯化：移动相，二氯甲烷/石油醚 2/1，最终纯的二氯甲烷。产量 2.1g 油。

^1H NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): 1.1 (s, 6H, $2 \times \text{CCH}_3$); 1.7 (m, 2H, COCH_2CH_2); 2.15 (s, 3H, ArCH_3); 2.55 (m, 2H, COCH_2CH_2); 3.55 (s, 3H, OCH_3); 7.2-7.7 (m, 7H, Ar-H) ppm.

10 实施例 XLII-1

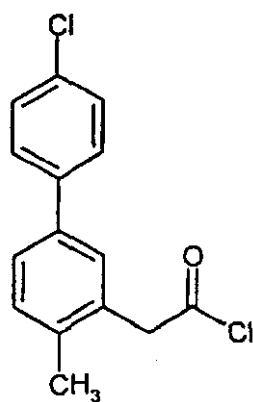
在 -15°C 下，将 34g 实施例 XXXII-2 化合物在 30ml THF 中的溶液

滴加入 60ml LDA 溶液 (2 摩尔, 1.1eq) 在 120ml THF 中的溶液中, 将混合物在 0℃ 下搅拌 1 小时. 在 -15℃ 下, 滴加入 10.3g 2,2-二甲基戊二酸酐在 20ml THF 中的溶液. 混合物在室温下搅拌 2 小时, 加入 180ml 水和 48g 氯化铵, 并将混合物用浓盐酸酸化. 中间体用醚萃取.

5 将萃取液浓缩, 残余物与 120g KOH 在 400ml 水中加热回流 2 天.

冷却后, 将混合物用浓盐酸酸化, 并用醚萃取. 余下的粗制产物在去除醚之后, 作进一步反应, 无需纯化. 产量 38.4g 油.

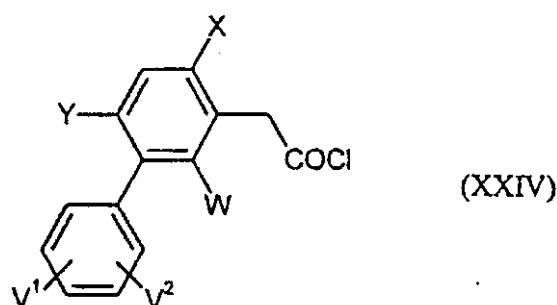
实施例 XXIV-1



10

将在 55ml 亚硫酸氯中的 65.2g 实施例 XXVII-2 化合物在 70℃ 下加热, 直到不再产生气体. 去除过量的亚硫酸氯, 残余物在高真空下蒸馏. 产量: 32g, m. p. 46℃.

15 通过实施例 (XXIV-1) 的方法和/或根据制备实施例 (XXIV) 化合物的一般程序, 获得下列式 (XXIV) 化合物

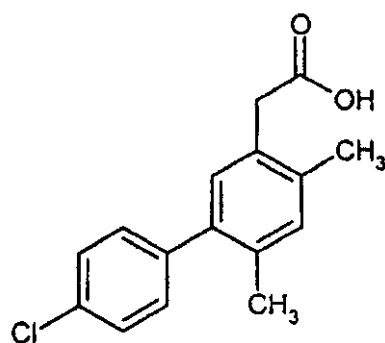


实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	m.p. (°C)
XXIV-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	*
XXIV-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	*
XXIV-4	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	*

*采用这些化合物无需进一步纯化就可用于制备式 (II) 或 (III) 化合物。

实施例 XXVII-1

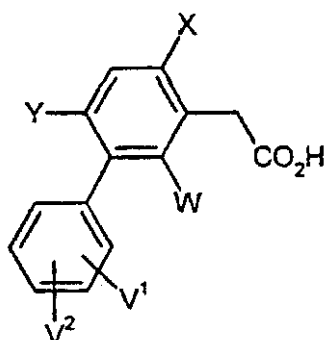
5



将在 280ml 水中的 3.04g LiOH 滴加入在 280ml THF 中的 35g 实施例 XXXII-1 化合物中，加入 10ml 乙醇，并将混合物在室温下搅拌过夜。之后将混合物浓缩，残余物与水混合，用 MTBE 萃取。水相用浓盐酸酸化，将混合物抽吸滤出，过滤残余物用己烷洗涤。产量 21g，m. p. 133°C。

通过实施例 (XXVII-1) 的方法，和/或根据制备式 (XXVII) 化合物的一般程序，获得下列化合物。

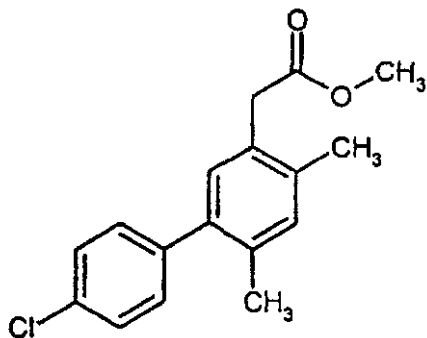
10



(XXVII)

实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	m.p. °C
XXVII-2	H	CH ₃	H	4-Cl	H	137
XXVII-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	138
XXVII-4	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	134
XXVII-5	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	H	153

实施例 XXXII - 1



5

方案 A

将 54g 实施例 XLV-1 化合物加入在 1 升甲醇中的 31g KOH 中，将混合物在室温下过夜。将混合物抽吸滤出，过滤残余物用甲醇洗涤。将滤液浓缩，将残余物与水混合，用二氯甲烷萃取。将有机相浓缩。产量 10g.

10

方案 B

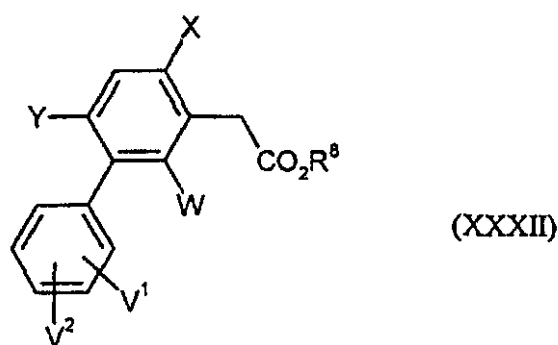
将 96g 3-溴-4,6-二甲基苯基乙酸甲酯、65g 4-氯苯基硼酸和

1.5g 双(三苯基膦)钨(II)氯化物在 1 升二甲氧基乙烷和 700ml 1M Na_2CO_3 溶液在回流下加热过夜。将混合物在水和 EA 中分配, 有机相用饱和氯化铵溶液、水和饱和氯化钠溶液洗涤并浓缩。产量 61g.

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ = 2.21, 2.31 (2s, 6H, Ar- CH_3); 3.63 (s, 2H, CH_2); 3.69 (s, 3H, OCH_3); 7.03-7.1 (2s, 2H, Ar-H); 7.25, 7.38 (AA', BB', 4H, Ar-H) ppm.

5

通过实施例 (XXXII-1), 方案 B, 和/或根据制备式 (XXXII) 化合物的一般程序, 获得下列式 (XXXII) 化合物

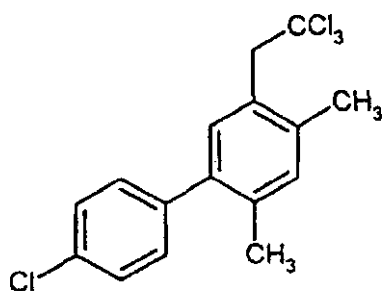


实施例序号	W	X	Y	V ¹	V ²	R ⁸	m.p. °C
XXXII-2	H	CH_3	H	4-Cl	H	CH_3	油
XXXII-3	CH_3	CH_3	CH_3	4-Cl	H	CH_3	68
XXXII-4	H	CH_3	CH_3	2-Cl	H	CH_3	油
XXXII-5	CH_3	CH_3	H	4-Cl	H	CH_3	油

10

实施例 XLV-1

15

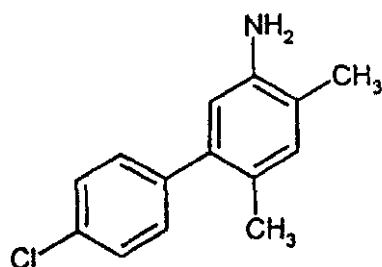


将 29.5g 无水氯化铜(II)导入 33g 异戊腈的 120ml 乙腈溶液中. 混合物与 271g 二氯乙烯($\text{CH}_2 = \text{CCl}_2$)混合, 随后与溶解于乙腈中的 43g 5 实施例 XLVI-1 化合物混合, 混合物在室温下搅拌, 直到不再产生气体. 之后将混合物倒入 800ml 冰-冷却的浓度为 20% 的盐酸中, 并用 MTBE 反复萃取. 有机相用浓度为 20% 的盐酸洗涤, 并浓缩.

产量 19g. 产物直接进一步反应, 无需任何纯化.

实施例 XLVI-1

10



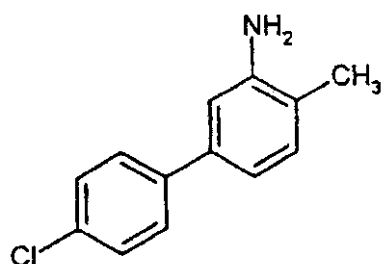
由 3-溴-4,6-二甲基苯胺和 4-氯苯基硼酸为原料, 通过 Suzuki 偶联获得, 反应按照实施例 XXXII-1 方案 B 那样进行.

产量 12g.

15

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ = 2.12 (s, 3H, Ar- CH_3), 2.18 (s, 3H, Ar- CH_3), 3.35 (brd, 2H, NH_2), 6.53 (s, 1H, Ar-H), 6.94 (s, 1H, Ar-H), 7.23 (AA',BB', 2H, Ar-H), 7.35 (AA',BB', 2H, Ar-H).

实施例 XLVI-2



由 3-溴-6-甲基苯胺为原料，通过相同的方法获得。M. p. 184℃。

实施例

5 桃蚜试验

溶剂：1 份重量的二甲基甲酰胺

乳化剂：1 份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

为制备活性化合物的适合制剂，将 1 份重量的活性化合物与所述的溶剂和乳化剂混合，并将此乳油用水稀释至所需的浓缩。

10 将长有大量桃蚜 (*Myzus persicae*) 的甘蓝 (*Brassica oleracea*) 叶通过浸入所需浓缩的活性化合物制剂中进行处理。

在所需的时间之后，测定杀死%。100% 指所有的蚜虫均被杀死；0% 指没有蚜虫被杀死。

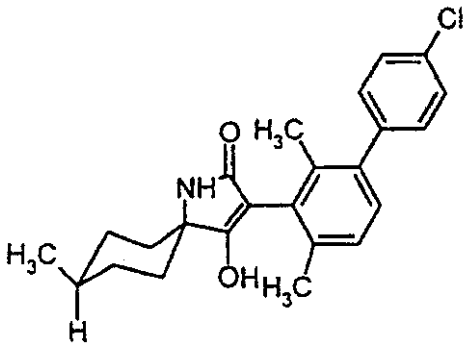
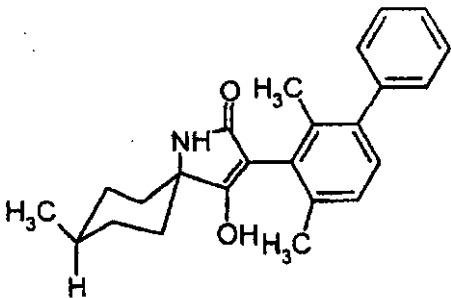
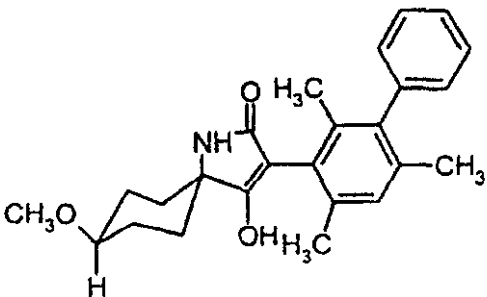
在此试验中，例如下列制备实施例化合物显示出良好的效力：

15

表格

植食性昆虫

桃蚜试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	6天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-3 	0.1	98
Ex. I-1-a-2 	0.1	95
Ex. I-1-a-6 	0.1	100

实施例

辣根猿叶甲试验

溶剂：7 份重量的二甲基甲酰胺

乳化剂：1 份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

- 5 为制备活性化合物的适合制剂，将 1 份重量的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合，并将此乳油用水稀释至所需的浓缩。

将甘蓝 (*Brassica oleracea*) 叶通过浸入所需浓缩的活性化合物制剂中，当叶片仍就湿润时，移入辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*) 幼虫。

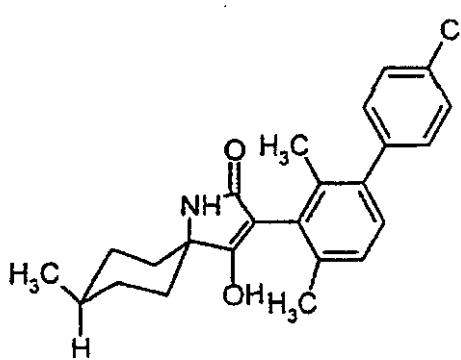
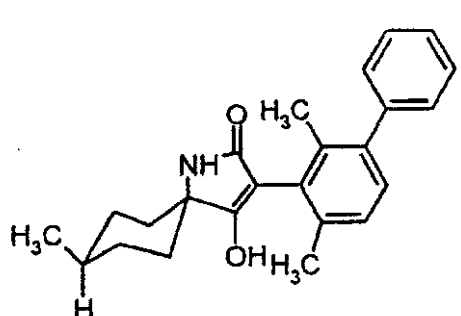
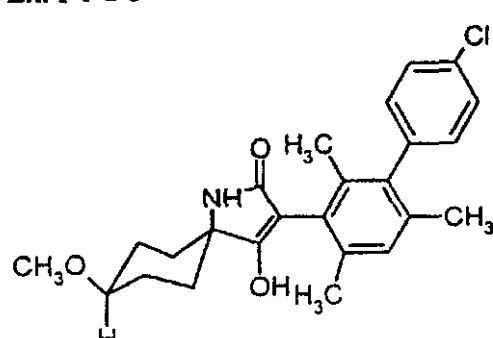
- 10 在所需的时间之后，测定杀死 %。100% 指所有的幼虫均被杀死；0% 指没有幼虫被杀死。

在此试验中，例如下列制备实施例化合物显示出良好的效力：

表格

植食性昆虫

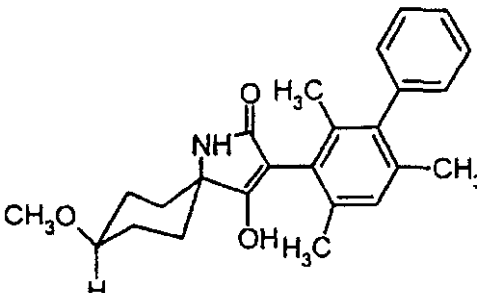
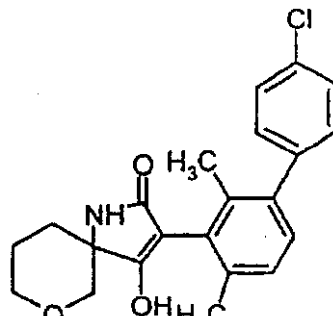
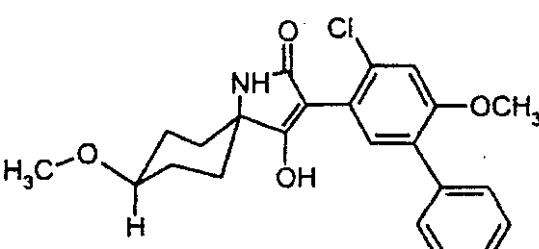
辣根猿叶甲幼虫试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-3 	0.1	100
Ex. I-1-a-2 	0.1	100
Ex. I-1-a-5 	0.1	100

表格 - 续

植食性昆虫

辣根猿叶甲幼虫试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-6 	0.1	100
Ex. I-1-a-7 	0.1	100
Ex. I-1-a-13 	0.1	100

实施例

斜纹叶蛾试验

溶剂：7份重量的二甲基甲酰胺

乳化剂：1份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

- 5 为制备活性化合物的适合制剂，将1份重量的活性化合物与所述的溶剂和乳化剂混合，并将此乳油用水稀释至所需的浓缩。

将甘蓝 (*Brassica oleracea*) 叶通过浸入所需浓缩的活性化合物制剂中，当叶片仍就湿润时，移入斜纹叶蛾 (*Spodoptera frugiperda*) 幼虫。

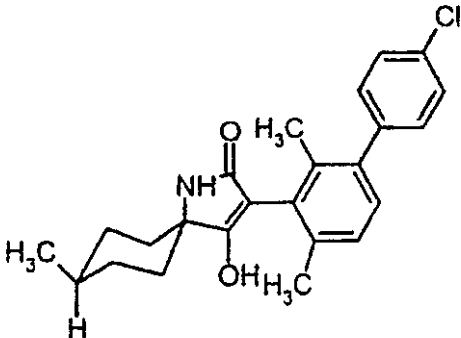
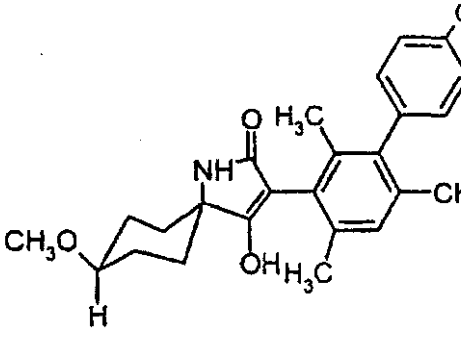
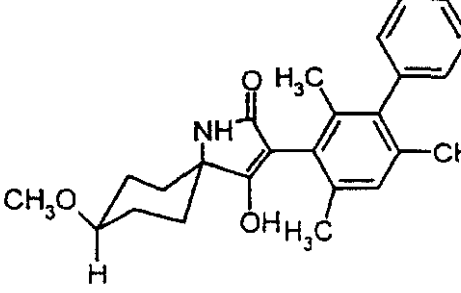
- 10 在所需的时间之后，测定杀死%。100%指所有的幼虫均被杀死；0%指没有幼虫被杀死。

在此试验中，例如下列制备实施例化合物显示出良好的效力：

表格

植食性昆虫

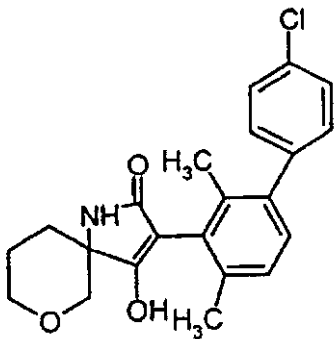
斜纹叶蛾幼虫试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-3 	0.1	100
Ex. I-1-a-5 	0.1	100
Ex. I-1-a-6 	0.1	100

表格 - 续

植食性昆虫

斜纹叶蛾幼虫试验

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-7 	0.1	100

实施例

叶螨试验(OP-抗性/浸蘸处理)

溶剂: 7份重量的二甲基甲酰胺

乳化剂: 1份重量的烷基芳基聚乙二醇醚

- 5 为制备活性化合物的适合制剂, 将1份重量的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合, 并将此乳油用水稀释至所需的浓缩。

将长有大量所有生长期的二点叶螨(*Tetranychus urticae*)的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)叶浸入所需浓缩的活性化合物制剂中。

在所需的时间之后, 测定杀死%。100%指所有的叶螨均被杀死;

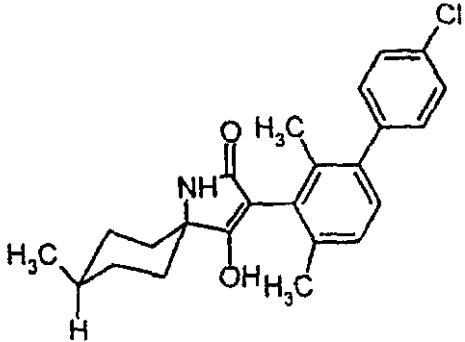
- 10 0%指没有叶螨被杀死。

在此试验中, 例如下列制备实施例化合物显示出良好的效力:

表格-续

植食性昆虫

叶螨试验(OP-抗性/浸蘸处理)

活性化合物	活性化合物浓度 (%)	7天后的杀死率 (%)
Ex. I-1-a-3 	0.1	100