

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
20. Januar 2011 (20.01.2011)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2011/006604 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 417/12 (2006.01) A01N 43/78 (2006.01)
C07D 277/42 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2010/004103

(22) Internationales Anmeldedatum:
6. Juli 2010 (06.07.2010)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

09165775.9 17. Juli 2009 (17.07.2009) EP
61/226,402 17. Juli 2009 (17.07.2009) US

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **ILG, Kerstin**
[DE/DE]; Isidor-Caro-Str.52, 51061 Köln (DE). **SEITZ,**
Thomas [DE/DE]; Rietherbach 10b, 40764 Langenfeld
(DE). **KUNZ, Klaus** [DE/DE]; Hochdähler Str. 3, 40625
Düsseldorf (DE). **FISCHER, Reiner** [DE/DE]; Nelly-
Sachs-Str. 23, 40789 Monheim (DE). **DAHMEN, Peter**
[DE/DE]; Altebrücker Str. 61, 41470 Neuss (DE).
VOERSTE, Arnd [DE/DE]; Mozartstr. 3-5, 50674 Köln

(DE). **WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike**
[DE/DE]; Oberer Markeweg 85, 56566 Neuwied (DE).
BENTING, Jürgen [DE/DE]; Amselstraße 7, 42799
Leichlingen (DE). **HARTMANN, Benoît** [FR/FR]; 113
bis rue du Commandant Charcot, F-69110 Sainte Foy les
Lyon (FR).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER CROPSCIENCE**
AG; Business Planning and Administration, Law and Pa-
tents, Patents and Licensing, Alfred-Nobel-Str. 50, Buil-
ding 6100, 40789 Monheim (DE).

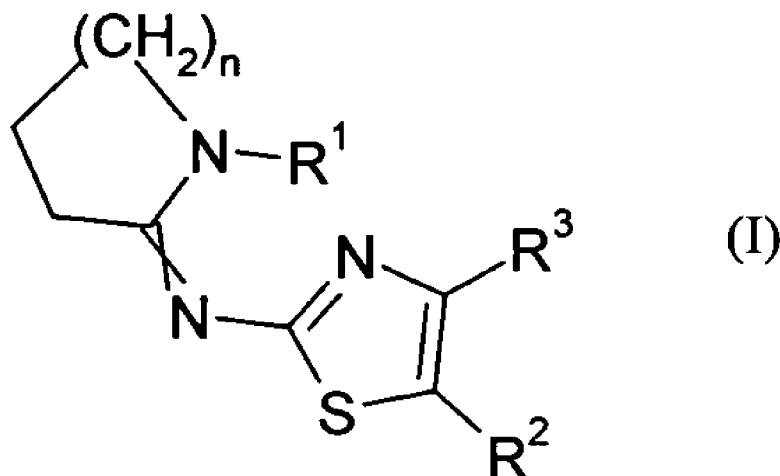
(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY,
BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN,
KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA,
MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG,
NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC,
SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ,
UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: SUBSTITUTED AMINOTHIAZOLES AND USE THEREOF AS FUNGICIDES

(54) Bezeichnung : SUBSTITUIERTE AMINOTHIAZOLE UND DEREN VERWENDUNG ALS FUNGIZIDE



(57) Abstract: The present invention relates to aminothiazoles of the general formula (I), to a method for the producing same, to the use of the aminothiazoles according to the invention for fighting undesired microorganisms, and to an agent for this purpose comprising the aminothiazoles of the invention. The invention further relates to a method for fighting undesired microorganisms by using the aminothiazoles of the invention on the microorganisms and/or in the habitat thereof.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Aminothiazole der allgemeinen Formel (I), ein Verfahren zu deren Herstellung, die Verwendung der erfindungsgemäßen Aminothiazole zum Bekämpfen von unerwünschten Mikroorganismen, so-
wie ein Mittel zu diesem Zweck, umfassend die erfindungsgemäßen Aminothiazole. Weiterhin betrifft die Erfindung ein Verfah-
ren zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen durch Ausbringen der erfindungsgemäßen Aminothiazole auf die Mikroor-
ganismen und/oder in deren Lebensraum.



WO 2011/006604 A1



RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)

Substituierte Aminothiazole und deren Verwendung als Fungizide

Die vorliegende Erfindung betrifft Aminothiazole der allgemeinen Formel (I), ein Verfahren zu deren Herstellung, die Verwendung der erfindungsgemäßen Aminothiazole zum Bekämpfen von unerwünschten Mikroorganismen, sowie ein Mittel zu diesem Zweck, umfassend die

5 erfindungsgemäßen Aminothiazole. Weiterhin betrifft die Erfindung ein Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen durch Ausbringen der erfindungsgemäßen Aminothiazole auf die Mikroorganismen und/oder in deren Lebensraum.

WO-A-00/046 184 offenbart die Verwendung von Amidinen als Fungizide.

WO-A-03/093 224 offenbart die Verwendung von Arylamidin-Derivaten als Fungizide.

10 WO-A-03/024 219 offenbart Fungizidzusammensetzungen umfassend wenigstens ein N2-Phenylamidin-Derivat in Kombination mit einem weiteren ausgewählten bekannten Wirkstoff.

WO-A-04/037 239 offenbart fungizide Medikamente auf der Basis von N2-Phenylamidin-Derivaten.

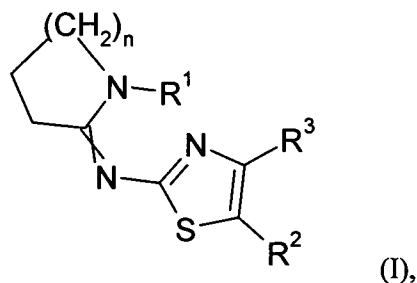
WO-A-07/031 513 offenbart Thiadiazolyl-substituierte Phenylamidine sowie deren Herstellung und

15 Verwendung als Fungizide.

Die Wirksamkeit der im Stand der Technik beschriebenen Amidine ist gut, lässt jedoch in manchen Fällen zu wünschen übrig.

Der vorliegenden Erfindung liegt daher die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit einer verbesserten fungiziden Wirksamkeit zur Verfügung zu stellen.

20 Die Aufgabe wurde überraschenderweise gelöst durch Aminothiazole der Formel (I)



in welcher

R¹ ausgewählt ist aus Wasserstoff; linearen, verzweigten C₁₋₁₂-Alkyl-, C₂₋₁₂-Alkenyl-, C₂₋₁₂-Alkynyl-, cyclischen C₃₋₈-Alkyl-, C₄₋₈-Alkenyl-, C₄₋₈-Alkynyl- oder C₅₋₁₈-Aryl-, C₇₋₁₉-Aralkyl- oder C₇₋₁₉-Alkaryl-Gruppen, -COOR', -COR', -CONR₂', wobei im Ringsystem aller

25

5 zuvor genannten cyclischen Gruppen ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor genannten Gruppen mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN und -CONR'₂ substituiert sein können, wobei R' Wasserstoff oder eine
 10 lineare oder verzweigte C₁₋₁₂-Alkyl-, C₁₋₆-Haloalkyl- oder cyclische C₃₋₈-Alkyl-Gruppe ist, die 1 bis 6 Halogenatome aufweisen kann;

R² ausgewählt ist aus Wasserstoff und linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl-, C₂₋₁₂-Alkenyl-, C₂₋₁₂-Alkynyl-, cyclischen C₃₋₈-Alkyl-, C₄₋₈-Alkenyl-, C₄₋₈-Alkynyl- oder C₅₋₁₈-Aryl-, C₇₋₁₉-Aralkyl- oder C₇₋₁₉-Alkaryl-Gruppen, wobei im Ringsystem aller zuvor genannten
 10 cyclischen Gruppen ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor genannten Gruppen mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN und -CONR'₂, substituiert sein können, wobei R' die obigen Bedeutungen hat;

R³ ausgewählt ist aus linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl-, C₂₋₁₂-Alkenyl-, C₂₋₁₂-Alkynyl-, cyclischen C₃₋₈-Alkyl-, C₄₋₈-Alkenyl-, C₄₋₈-Alkynyl- oder C₅₋₁₈-Aryl-, C₇₋₁₉-Aralkyl- oder C₇₋₁₉-Alkaryl-Gruppen, wobei im Ringsystem aller zuvor genannten cyclischen Gruppen
 15 ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor genannten Gruppen mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN, C₅₋₁₈-Aryl-, C₅₋₁₈-Aryloxy-, C₂₋₁₂-Alkenyloxy-, C₇₋₁₉-Aralkyl- und -CONR'₂, substituiert sein können, wobei
 20 R' die obigen Bedeutungen hat und die C₅₋₁₈-Aryl-, C₅₋₁₈-Aryloxy-, C₂₋₁₂-Alkenyloxy- und C₇₋₁₉-Aralkyl-Gruppen mit einem, zwei oder mehreren Resten substituiert sein können, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN, Aryloxy- und -CONR'₂, worin R' die
 25 obigen Bedeutungen hat;

n 0, 1 oder 2 ist,

oder deren Salze, N-Oxide, Metallkomplexe und Stereoisomere.

Allgemeine Definitionen

Im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung umfasst der Begriff Halogene (X), soweit nicht anders definiert, solche Elemente, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Fluor, Chlor, Brom und Iod, wobei Fluor, Chlor und Brom bevorzugt und Fluor und Chlor besonders bevorzugt verwendet werden.

Gegebenenfalls substituierte Gruppen können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

Mit einem oder mehreren Halogenatomen (-X) substituierte Alkyl-Gruppen sind beispielsweise ausgewählt aus Trifluormethyl (CF_3), Difluormethyl (CHF_2), CF_3CH_2 , ClCH_2 , CF_3CCl_2 .

- 10 Alkyl-Gruppen sind im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung, soweit nicht abweichend definiert, lineare, verzweigte oder ringförmige Kohlenwasserstoff-Gruppen, die optional eine, zwei oder mehrere einfache oder zweifache Unsättigungen oder ein, zwei oder mehrere Heteroatome, die ausgewählt sind aus O, N, P und S aufweisen können. Außerdem können die erfindungsgemäßen Alkyl-Gruppen optional durch weitere Gruppen substituiert sein, die ausgewählt sind aus -R',
- 15 Halogen- (-X), Alkoxy- (-OR'), Thioether- oder Mercapto- (-SR'), Amino- (-NR'₂), Silyl- (-SiR'₃), Carboxyl- (-COOR'), Cyan- (-CN), Acyl- (-C(=O)R') und Amid-Gruppen (-CONR'₂), wobei R' Wasserstoff oder eine C₁₋₁₂-Alkyl-Gruppe, vorzugsweise C₂₋₁₀-Alkyl-Gruppe, besonders bevorzugt C₃₋₈-Alkyl-Gruppe ist, die ein oder mehrere Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, aufweisen kann.
- 20 Die Definition C₁₋₁₂-Alkyl umfasst den größten hierin definierten Bereich für eine Alkyl-Gruppe. Im Einzelnen umfasst diese Definition beispielsweise die Bedeutungen Methyl, Ethyl, n-, iso-Propyl, n-, iso-, sec- und t-Butyl, n-Pentyl, n-Hexyl, 1,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, n-Heptyl, n-Nonyl, n-Decyl, n-Undecyl, n-Dodecyl.

- Alkenyl-Gruppen sind im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung, soweit nicht
- 25 abweichend definiert, lineare, verzweigte oder ringförmige Kohlenwasserstoff-Gruppen, die wenigstens eine einfache Unsättigung (Doppelbindung) enthalten und optional eine, zwei oder mehrere einfache oder zweifache Unsättigungen oder ein, zwei oder mehrere Heteroatome, die ausgewählt sind aus O, N, P und S aufweisen können. Außerdem können die erfindungsgemäßen Alkenyl-Gruppen optional durch weitere Gruppen substituiert sein, die ausgewählt sind aus -R',
- 30 Halogen- (-X), Alkoxy- (-OR'), Thioether- oder Mercapto- (-SR'), Amino- (-NR'₂), Silyl- (-SiR'₃), Carboxyl- (-COOR'), Cyan- (-CN), Acyl- (-C(=O)R') und Amid-Gruppen (-CONR'₂), wobei R' Wasserstoff oder eine C₁₋₁₂-Alkyl-Gruppe, vorzugsweise C₂₋₁₀-Alkyl-Gruppe, besonders bevorzugt

C₃₋₈-Alkyl-Gruppe ist, die ein oder mehrere Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, aufweisen kann.

Die Definition C₂-C₁₂-Alkenyl umfasst den größten hierin definierten Bereich für eine Alkenyl-Gruppe. Im Einzelnen umfasst diese Definition beispielsweise die Bedeutungen Vinyl; Allyl (2-Propenyl), Isopropenyl (1-Methylethenyl); But-1-enyl (Crotyl), But-2-enyl, But-3-enyl; Hex-1-enyl, Hex-2-enyl, Hex-3-enyl, Hex-4-enyl, Hex-5-enyl; Hept-1-enyl, Hept-2-enyl, Hept-3-enyl, Hept-4-enyl, Hept-5-enyl, Hept-6-enyl; Oct-1-enyl, Oct-2-enyl, Oct-3-enyl, Oct-4-enyl, Oct-5-enyl, Oct-6-enyl, Oct-7-enyl; Non-1-enyl, Non-2-enyl, Non-3-enyl, Non-4-enyl, Non-5-enyl, Non-6-enyl, Non-7-enyl, Non-8-enyl; Dec-1-enyl, Dec-2-enyl, Dec-3-enyl, Dec-4-enyl, Dec-5-enyl, Dec-6-enyl, Dec-7-enyl, Dec-8-enyl, Dec-9-enyl; Undec-1-enyl, Undec-2-enyl, Undec-3-enyl, Undec-4-enyl, Undec-5-enyl, Undec-6-enyl, Undec-7-enyl, Undec-8-enyl, Undec-9-enyl, Undec-10-enyl; Dodec-1-enyl, Dodec-2-enyl, Dodec-3-enyl, Dodec-4-enyl, Dodec-5-enyl, Dodec-6-enyl, Dodec-7-enyl, Dodec-8-enyl, Dodec-9-enyl, Dodec-10-enyl, Dodec-11-enyl; Buta-1,3-dienyl, Penta-1,3-dienyl.

Alkinyl-Gruppen sind im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung, soweit nicht abweichend definiert, lineare, verzweigte oder ringförmige Kohlenwasserstoff-Gruppen, die wenigstens eine zweifache Unsättigung (Dreifachbindung) enthalten und optional eine, zwei oder mehrere einfache oder zweifache Unsättigungen oder ein, zwei oder mehrere Heteroatome, die ausgewählt sind aus O, N, P und S, aufweisen können. Außerdem können die erfindungsgemäßen Alkinyl-Gruppen optional durch weitere Gruppen substituiert sein, die ausgewählt sind aus -R', Halogen- (-X), Alkoxy- (-OR'), Thioether- oder Mercapto- (-SR'), Amino- (-NR'₂), Silyl- (-SiR'₃), Carboxyl- (-COOR'), Cyan- (-CN), Acyl- (-C(=O)R') und Amid-Gruppen (-CONR'₂), wobei R' Wasserstoff oder eine lineare, verzweigte oder cyclische C₁₋₁₂-Alkyl-Gruppe ist, die ein oder mehrere Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, aufweisen kann.

Die Definition C₂-C₁₂-Alkinyl umfasst den größten hierin definierten Bereich für eine Alkinyl-Gruppe. Im Einzelnen umfasst diese Definition beispielsweise die Bedeutungen Ethinyl (Acetylenyl); Prop-1-inyl und Prop-2-inyl.

Die Definition C₃-C₈-Cycloalkyl umfasst monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 8 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl.

Aryl-Gruppen sind im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung, soweit nicht abweichend definiert, aromatische Kohlenwasserstoff-Gruppen, die ein, zwei oder mehrere Heteroatome, die ausgewählt sind aus O, N, P und S aufweisen können und optional durch weitere Gruppen substituiert sein können, die ausgewählt sind aus -R', Halogen- (-X), Alkoxy- (-OR'), Thioether-

oder Mercapto- (-SR'), Amino- (-NR'₂), Silyl- (-SiR'₃), Carboxyl- (-COOR'), Cyan- (-CN), Acyl- (-C(=O)R') und Amid-Gruppen (-CONR'₂'), wobei R' Wasserstoff oder eine C₁₋₁₂-Alkyl-Gruppe, vorzugsweise C₂₋₁₀-Alkyl-Gruppe, besonders bevorzugt C₃₋₈-Alkyl-Gruppe ist, die ein oder mehrere Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, aufweisen kann.

- 5 Die Definition C₅₋₁₈-Aryl umfasst den größten hierin definierten Bereich für eine Aryl-Gruppe mit 5 bis 18 Gerüst-Atomen, wobei die C-Atome gegen Heteroatome ausgetauscht sein können. Im Einzelnen umfasst diese Definition beispielsweise die Bedeutungen Cyclopentadienyl, Phenyl, Cycloheptatrienyl, Cyclooctatetraenyl, Naphthyl und Anthracenyl; 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isioxazolyl, 4-Isioxazolyl, 5-Isioxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-
 10 Isothiazolyl, 5-Isouthiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl; 1-Pyrrolyl, 1-Pyrazolyl, 1,2,4-Triazol-1-yl, 1-Imidazolyl, 1,2,3-Triazol-1-yl, 1,3,4-Triazol-1-yl; 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-
 15 Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl.

- Arylalkyl-Gruppen (Aralkyl-Gruppen) sind im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung, soweit nicht abweichend definiert, durch Aryl-Gruppen substituierte Alkyl-Gruppen, die eine C₁₋₈-Alkylenkette aufweisen können und im Arylgerüst oder der Alkylenkette durch eines oder mehrere Heteroatome, die ausgewählt sind aus O, N, P und S und optional durch weitere Gruppen
 20 substituiert sein können, die ausgewählt sind aus -R', Halogen- (-X), Alkoxy- (-OR'), Thioether- oder Mercapto- (-SR'), Amino- (-NR'₂), Silyl- (-SiR'₃), Carboxyl- (-COOR'), Cyan- (-CN), Acyl- (-C(=O)R') und Amid-Gruppen (-CONR'₂'), wobei R' Wasserstoff oder eine C₁₋₁₂-Alkyl-Gruppe, vorzugsweise C₂₋₁₀-Alkyl-Gruppe, besonders bevorzugt C₃₋₈-Alkyl-Gruppe ist, die ein oder mehrere Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, aufweisen kann.

- 25 Die Definition C₇₋₁₉-Aralkyl-Gruppe umfasst den größten hierin definierten Bereich für einen Arylalkyl-Gruppe mit insgesamt 7 bis 19 Atomen in Gerüst und Alkylenkette. Im Einzelnen umfasst diese Definition beispielsweise die Bedeutungen Benzyl- und Phenylethyl-.

- Alkylaryl-Gruppen (Alkaryl-Gruppen) sind im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung, soweit nicht abweichend definiert, durch Alkyl-Gruppen substituierte Aryl-Gruppen, die eine C₁₋₈-
 30 Alkylenkette aufweisen können und im Arylgerüst oder der Alkylenkette durch eines oder mehrere Heteroatome, die ausgewählt sind aus O, N, P und S und optional durch weitere Gruppen substituiert sein können, die ausgewählt sind aus -R', Halogen- (-X), Alkoxy- (-OR'), Thioether- oder Mercapto- (-SR'), Amino- (-NR'₂), Silyl- (-SiR'₃), Carboxyl- (-COOR'), Cyan- (-CN), Acyl- (-C(=O)R') und Amid-Gruppen (-CONR'₂'), wobei R' Wasserstoff oder eine C₁₋₁₂-Alkyl-Gruppe,

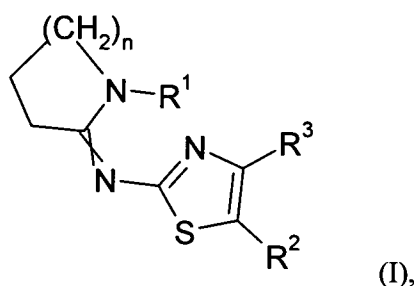
vorzugsweise C₂₋₁₀-Alkyl-Gruppe, besonders bevorzugt C₃₋₈-Alkyl-Gruppe ist, die ein oder mehrere Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, aufweisen kann.

Die Definition C₇₋₁₉-Alkylaryl-Gruppe umfasst den größten hierin definierten Bereich für einen Alkylaryl-Gruppe mit insgesamt 7 bis 19 Atomen in Gerüst und Alkylenkette. Im Einzelnen umfasst diese Definition beispielsweise die Bedeutungen Toly-, 2,3-, 2,4-, 2,5-, 2,6-, 3,4- oder 3,5-Dimethylphenyl.

Die Alkyl-, Alkenyl-, Alkynyl-, Aryl-, Alkaryl- und Aralkylgruppen können zudem ein oder mehrere Heteroatome aufweisen, die - soweit nicht abweichend definiert - ausgewählt sind aus N, O, P und S. Die Heteroatome ersetzen dabei die bezifferten Kohlenstoffatome.

Die erfindungsgemäßen Amino-thiazole können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z.B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren, beliebige Mischungen dieser Isomeren, sowie die möglichen tautomeren Formen offenbart und beansprucht.

Die erfindungsgemäßen Amino-thiazole sind Verbindungen der Formel (I)



oder deren Salze, N-Oxide, Metallkomplexe und Stereoisomere.

In Formel (I) haben die Gruppen die im Folgenden definierten Bedeutungen. Die getroffenen Definitionen gelten für alle Zwischenprodukte gleichermaßen:

R¹ ist ausgewählt aus Wasserstoff; linearen, verzweigten C₁₋₁₂-Alkyl-, C₂₋₁₂-Alkenyl-, C₂₋₁₂-Alkynyl-, cyclischen C₃₋₈-Alkyl-, C₄₋₈-Alkenyl-, C₄₋₈-Alkynyl- oder C₅₋₁₈-Aryl-, C₇₋₁₉-Aralkyl- oder C₇₋₁₉-Alkaryl-Gruppen, -COOR', -COR', -CONR₂', wobei im Ringsystem aller zuvor genannten cyclischen Gruppen ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor genannten Gruppen mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN und -CONR₂' substituiert

sein können, wobei R' Wasserstoff oder eine lineare oder verzweigte C₁₋₁₂-Alkyl-, C₁₋₆-Haloalkyl- oder cyclische C₃₋₈-Alkyl-Gruppe ist, die 1 bis 6 Halogenatome aufweisen kann;

R² ist ausgewählt aus Wasserstoff und linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl-, C₂₋₁₂-Alkenyl-, C₂₋₁₂-Alkynyl-, cyclischen C₃₋₈-Alkyl-, C₄₋₈-Alkenyl-, C₄₋₈-Alkynyl- oder C₅₋₁₈-Aryl-, C₇₋₁₉-Aralkyl- oder C₇₋₁₉-Alkaryl-Gruppen, wobei im Ringsystem aller zuvor genannten cyclischen Gruppen ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor genannten Gruppen mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN und -CONR'₂, substituiert sein können, wobei R' die obigen Bedeutungen hat;

R³ ist ausgewählt aus linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl-, C₂₋₁₂-Alkenyl-, C₂₋₁₂-Alkynyl-, cyclischen C₃₋₈-Alkyl-, C₄₋₈-Alkenyl-, C₄₋₈-Alkynyl- oder C₅₋₁₈-Aryl-, C₇₋₁₉-Aralkyl- oder C₇₋₁₉-Alkaryl-Gruppen, wobei im Ringsystem aller zuvor genannten cyclischen Gruppen ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor genannten Gruppen mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN, C₅₋₁₈-Aryl-, C₅₋₁₈-Aryloxy-, C₂₋₁₂-Alkenyloxy-, C₇₋₁₉-Aralkyl- und -CONR'₂, substituiert sein können, wobei R' die obigen Bedeutungen hat und die C₅₋₁₈-Aryl-, C₅₋₁₈-Aryloxy-, C₂₋₁₂-Alkenyloxy- und C₇₋₁₉-Aralkyl-Gruppen mit einem, zwei oder mehreren Resten substituiert sein können, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN, Aryloxy- und -CONR'₂, worin R' die obigen Bedeutungen hat;

n ist 0, 1 oder 2.

In Formel (I) haben die Gruppen die im Folgenden definierten *bevorzugten* Bedeutungen. Die als *bevorzugt* getroffenen Definitionen gelten für alle Zwischenprodukte gleichermaßen:

R¹ ist ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, C₁₋₈-Alkyl-Gruppen, -COOR', -COR', -CONR'₂, wobei R' die obigen Bedeutungen hat;

R² ist ausgewählt aus Wasserstoff und linearen oder verzweigten C₁₋₈-Alkyl-Gruppen;

R³ ist ausgewählt aus Phenyl- oder Phenyl-C₁₋₄-Alkyl-Gruppen, die am Phenylring mit einem, zwei oder mehreren Halogenatomen, Phenyl-, Phenoxy-, C₂₋₆-Alkenyloxy-, C₁₋₆-Alkoxy-, Phenyl-C₁₋₄-Alkyl-Gruppen oder C₁₋₅-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können oder an die fünf, sechs oder siebengliedrige carbocyclische oder heterocyclische Ringe anneliert sein können und die im Ring ein oder zwei Heteroatome aufweisen können, die ausgewählt

sind aus O und N, wobei alle genannten Gruppen mit Halogenatomen, C₁₋₆-Alkyl-, C₁₋₆-Alkoxy- oder C₁₋₅-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;

n ist 0 oder 1.

In Formel (I) haben die Reste die im Folgenden definierten *besonders bevorzugten* Bedeutungen.

5 Die als *besonders bevorzugt* getroffenen Definitionen gelten für alle Zwischenprodukte gleichermaßen:

R¹ ist ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, C₁₋₈-Alkyl-Gruppen, -COOR', -COR', -CONR₂'

R² ist Wasserstoff;

10 R³ ist ausgewählt aus

- Phenyl-, Benzyl- oder Phenethyl-Gruppen, die mit einem, zwei oder mehreren Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen oder mit Phenyl- oder Benzyl-Gruppen substituiert sein können, wobei letztere Phenyl- oder Benzyl-Gruppen mit einem, zwei oder mehreren Halogenatomen, Methyl- oder Methoxy-Gruppen substituiert sein können;

- Phenoxyphenyl- oder Diphenoxyphenyl-Gruppen, die im Phenoxy-Rest mit einem oder zwei Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;

20 - C₂₋₆-Alkenyloxyphenyl-Gruppen, die mit einem oder zwei Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;

- C₁₋₆-Alkoxyphenyl-Gruppen, die mit einem oder zwei Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;

- 1,3-Benzodioxol-5-yl-Gruppen;

25 - Pyridyl-Gruppen, die mit einem oder zwei Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;

- C₃₋₆-Cycloalkyl-C₁₋₄-Alkyl-Gruppen

n ist 1.

Die vorliegende Erfindung betrifft darüber hinaus auch die Salze, N-Oxide, Metallkomplexe der zuvor beschriebenen Amino-thiazole und deren Stereoisomere. Insbesondere die E- und Z-Isomere bezüglich der C=N-Doppelbindung oder Mischungen dieser.

Je nach Art der oben definierten Substituenten weisen die Amino-thiazole der Formel (I) saure oder
5 basische Eigenschaften auf und können mit anorganischen oder organischen Säuren oder mit Basen oder mit Metallionen Salze, gegebenenfalls auch innere Salze oder Addukte bilden.

Als Metallionen kommen insbesondere die Ionen der Elemente der zweiten Hauptgruppe, insbesondere Calcium und Magnesium, der dritten und vierten Hauptgruppe, insbesondere Aluminium, Zinn und Blei, sowie der ersten bis achten Nebengruppe, insbesondere Chrom,
10 Mangan, Eisen, Kobalt, Nickel, Kupfer, Zink und andere in Betracht. Besonders bevorzugt sind die Metallionen der Elemente der vierten Periode. Die Metalle können dabei in den verschiedenen ihnen zukommenden Wertigkeiten vorliegen.

Tragen die Amino-thiazole der Formel (I) Hydroxy, Carboxy oder andere, saure Eigenschaften induzierende Gruppen, so können diese Verbindungen mit Basen zu Salzen umgesetzt werden.

15 Geeignete Basen sind beispielsweise Hydroxide, Carbonate, Hydrogencarbonate der Alkali- und Erdalkalimetalle, insbesondere die von Natrium, Kalium, Magnesium und Calcium, weiterhin Ammoniak, primäre, sekundäre und tertiäre Amine mit (C₁-C₄)-Alkyl-Gruppen, Mono-, Di- und Trialkanolamine von (C₁-C₄)-Alkanolen, Cholin sowie Chlorcholin.

Tragen die Amino-thiazole der Formel (I) Amino, Alkylamino oder andere, basische Eigenschaften
20 induzierende Gruppen, so können diese Verbindungen mit Säuren zu Salzen umgesetzt werden.

Beispiele für anorganische Säuren sind Halogenwasserstoffsäuren wie Fluorwasserstoff, Chlorwasserstoff, Bromwasserstoff und Iodwasserstoff, Schwefelsäure, Phosphorsäure und Salpetersäure und saure Salze wie NaHSO₄ und KHSO₄.

Als organische Säuren kommen beispielsweise Ameisensäure, Kohlensäure und Alkansäuren wie
25 Essigsäure, Trifluoressigsäure, Trichloressigsäure und Propionsäure sowie Glycolsäure, Thiocyanensäure, Milchsäure, Bernsteinsäure, Zitronensäure, Benzoesäure, Zimtsäure, Oxal-säure, Alkylsulfonsäuren (Sulfonsäuren mit geradkettigen oder verzweigten Alkyl-Gruppen mit 1 bis 20 Kohlenstoffatomen), Arylsulfonsäuren oder -disulfonsäuren (aromatische Gruppen wie Phenyl und Naphthyl welche ein oder zwei Sulfonsäuregruppen tragen), Alkylphosphon-säuren
30 (Phosphonsäuren mit geradkettigen oder verzweigten Alkyl-Gruppen mit 1 bis 20 Kohlenstoffatomen), Arylphosphonsäuren oder -diphosphonsäuren (aromatische Reste wie Phenyl und Naphthyl, welche ein oder zwei Phosphonsäure-Gruppen tragen), wobei die Alkyl- bzw. Aryl-

Gruppen weitere Substituenten tragen können, z.B. p-Toluolsulfonsäure, Salicylsäure, p-Aminosalicylsäure, 2-Phenoxybenzoesäure, 2-Acetoxybenzoesäure, Saccharin etc.

Die so erhältlichen Salze weisen ebenfalls fungizide Eigenschaften auf.

Im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung besonders bevorzugte Aminothiazole der Formel (I) sind ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus:

4-[2-(2,4-Dimethylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Bromphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,4-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Phenoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[3,5-Bis(trifluormethyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-Chlor-3-(trifluormethyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[4-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Phenoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Dichlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-tert-Butyl-4-chlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-tert-Butylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-{2-[4-Chlor-3-(trifluormethyl)phenoxy]phenyl}-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(trifluormethoxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 1-[(2E/Z)-2-({4-[2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2-Phenoxyphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 4-(3,4-Difluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,5-Difluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(trifluormethyl)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(prop-2-en-1-yloxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Ethoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,3-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,3-Difluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-Fluor-3-(trifluormethyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3,4-Dimethoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(1,3-Benzodioxol-5-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3,5-Difluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Chlor-4-fluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Chlorphenyl)-5-methyl-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-tert-Butylphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2-Ethoxyphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(4-Chlorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2,3-Dichlorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2,3-Difluorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-[2-Fluor-3-

(trifluormethyl)phenyl]-1,3-thiazol-2-yl} imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-{[4-(1,3-Benzodioxol-5-yl)-1,3-thiazol-2-yl]imino}piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-{[4-(3,5-Difluorophenyl)-1,3-thiazol-2-yl]imino}piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-{[4-(3-Chlor-4-fluorophenyl)-1,3-thiazol-2-yl]imino}piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-{[4-(4-Chlorophenyl)-5-methyl-1,3-thiazol-2-yl]imino}piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-{[4-(2,3-Difluorophenyl)-5-methyl-1,3-thiazol-2-yl]imino}piperidin-1-yl]ethanon, 4-(2,3-Difluorophenyl)-5-methyl-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[3-(trifluormethyl)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Bromophenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[3-(2,2-Dimethylpropyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Bromophenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[4-(Difluoromethoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[4-(trifluoromethoxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,6-Dichlorophenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3,4-Dichlorophenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Chlorpyridin-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Fluorophenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3,5-Dichlorophenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Methoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Methoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,6-Dimethylpyridin-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Chlorophenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Methylphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-(pyridin-2-yl)-1,3-thiazol-2-amin, 4-(6-Methylpyridin-2-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(6-Chlorpyridin-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(Biphenyl-2-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3'-Methylbiphenyl-2-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3',4'-Dichlorbiphenyl-2-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4'-Methoxybiphenyl-2-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4'-Methoxybiphenyl-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Chlorbenzyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Chlorbenzyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3'-Methylbiphenyl-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(Cyclopropylmethyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(1-Phenylethyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Chlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Fluorophenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,6-Difluorophenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(2,3,4-trifluorophenoxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3,4-Difluorophenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Methylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,5-Difluorophenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Benzylphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(2,4,6-trifluorophenoxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-Fluorphen-

oxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Bromphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-Chlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2-Bromphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-Bromphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Difluorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3,5-Dichlorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Fluorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,6-Dichlorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3,4-Dichlorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Chlorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Benzylphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Dimethylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[4-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Phenoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Dichlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-tert-Butylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-tert-Butyl-4-chlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,4-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[3-(trifluormethyl)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Bromphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Bromphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin.

In einer bevorzugten Ausführungsform der vorliegenden Erfindung sind folgende Verbindungen von der Formel (I) (bzw. Formel (Ia) bzw. Formel (Ib)) ausgenommen:

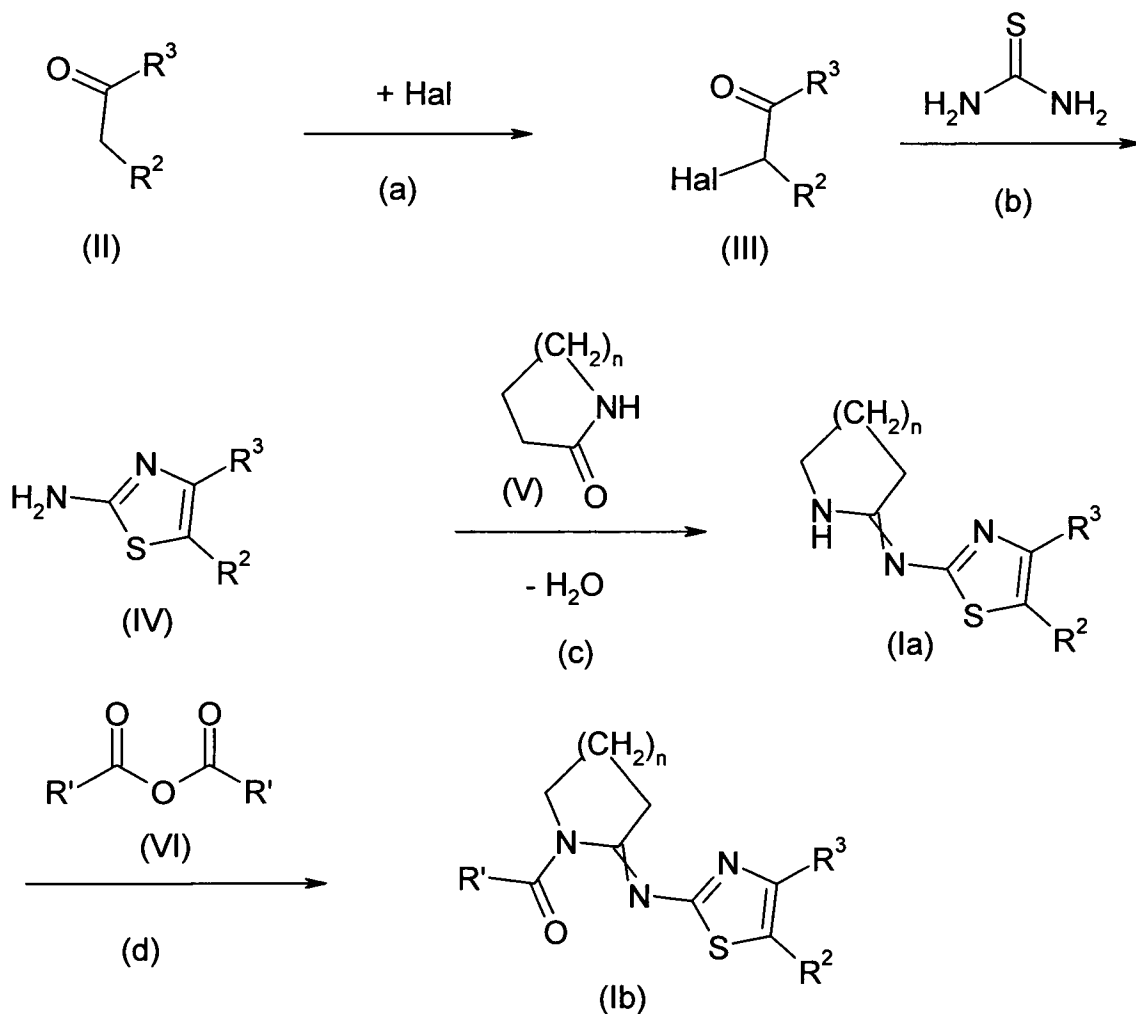
- Verbindungen der Formel (I) bei denen $n=0$, R^1 = Methyl, R^2 = Wasserstoff, R^3 = Phenyl, Methyl oder 4-Bromphenyl, (Verbindungen 6a-6c; Liebscher et al, Synthesis, Georg Thieme Verlag, Stuttgart, DE, Bd. 12, 1. Januar 1989, S. 970),
- Verbindung der Formel (I) bei der $n = 0$, R^1 = Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff, R^3 = 4-Fluorphenyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 300851-72-3; XP002563997; Database Chemcats, Database accession no. 2086369943; XP002564129),
- Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 = Wasserstoff, R^2 = Methyl, R^3 = 4-OH-Phenyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 328039-30-1; XP002564118),

- Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 =Wasserstoff, R^2 = Methyl, R^3 = 4-EtO-Phenyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 300568-62-1; XP002564122),
 - Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 =Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff, R^3 = 4-F₂CH-O-Phenyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 380183-46-0; XP002564124),
 - Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 =Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff, R^3 = 4-Bromphenyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 377760-05-9; XP002564125),
 - Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 =Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff, R^3 = tert. Butyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 753466-17-0; XP002564128),
 - Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 =Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff, R^3 = Methyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 753465-01-9; XP002565543),
 - Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 =Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff, R^3 = 4-Me-O-Phenyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 887203-42-1 und 887203-39-6; XP002564134; XP002565544),
 - Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 =Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff, R^3 = 4-Me-Phenyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 887203-36-3; XP002565545),
 - Verbindung der Formel (I) bei der $n=0$, R^1 =Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff, R^3 = Phenyl (Database Registry, Chemical Abstracts Service, Database accession no. 887203-33-0; XP002565546).
- In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform der vorliegenden Erfindung sind folgende Verbindungen von der Formel (IV) ausgenommen:
- Verbindung der Formel (IV) bei der R^2 = Wasserstoff und R^3 = -CH₂COOH (Aldrich „Catalogue Handbook of Fine Chemicals“ 1990, Aldrich, Brussel, S. 87,
 - Verbindung der Formel (IV) der der R^2 -[CH₂]_(3, 4 oder 5)CO₂H und R^3 = Methyl (Swain G; Journal of the Chemical Society, London England, 1. Jan 1949),

- Verbindung der Formel (IV) bei der R^2 = Methyl und R^3 = Methyl (Prithwi Nath et al, Journal of the Chemical Society, Calcutta, Ind, Bd. 37, Nr. 4, 1. Jan 1960)
 - Verbindung der Formel (IV) bei der R^2 = Phenyl oder Wasserstoff und R^3 = Styryl (Southwick, Sapper; Journal of Organic Chemistry, Bd, 19, 1954)
- 5 - Verbindung der Formel (I) bei der R^2 = Wasserstoff und R^3 = n-Butyl (Erlenmeyer H et al., Helvetica Chimica Acta, Verlag Helvetica Chimica Acta, Basel, CH, Bd. 32, Nr. 1; 1. Febr. 1949).

Herstellung der erfindungsgemäßen Amino-thiazole der Formel (I)

Die erfindungsgemäßen Amino-thiazole sind beispielsweise erhältlich durch das Verfahren gemäß
 10 dem nachfolgenden Schema 1.



Schema 1

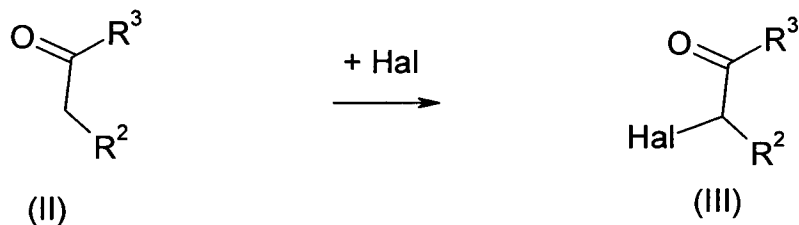
Die in Schema 1 dargestellten Verfahrensschritte (a) und (b) sind im Stand der Technik, beispielsweise durch Molecules, 2003, 8, 793-865 (a) oder T.M. Potewar et al in Tetrahedron 64 (2008) 5019-5022 (b), vorbeschrieben. Die Umsetzung der 2-Aminothiazole der Formel (IV) zu den Verbindungen der Formel (VI) in Schritt (c) und deren folgende Umsetzung zu den substituierten Thiazolen der Formel (I) gemäß Schritt (d) bilden weitere Gegenstände der vorliegenden Erfindung.

Das erfindungsgemäße Verfahren umfasst daher wenigstens einen der Teilschritte (c) und (d), bevorzugt umfasst das Verfahren wenigstens die Kombination der Teilschritte (c) und (d).

Die einzelnen Reaktionsschritte werden in Folge genauer erläutert:

Schritt (a) Herstellung der α -Halogenketone der Formel (III)

Die Synthese der α -Halogenketone der Formel (III) kann durch Halogenierung von α -Methylenketonen der Formel II erfolgen, die Reaktion ist im Stand der Technik, beispielsweise in Molecules, 2003, 8, 793-865, vorbeschrieben. Das Halogenatom (Hal) ist ausgewählt aus Chlor oder Brom, vorzugsweise ist Hal=Brom.



Die Halogenierung kann mit den üblichen Halogenierungsreagenzien durchgeführt werden, beispielsweise seien Cl_2 und Br_2 , PCl_5 , PCl_3 , POCl_3 , SO_2Cl_2 oder SOCl_2 genannt.

Die Halogenierung der α -Methylenketone der Formel II kann in Substanz oder in einem Lösungsmittel erfolgen, vorzugsweise wird die Reaktion in einem Lösungsmittel durchgeführt, welches ausgewählt ist aus üblichen, bei den vorherrschenden Reaktionsbedingungen inerten Lösungsmitteln.

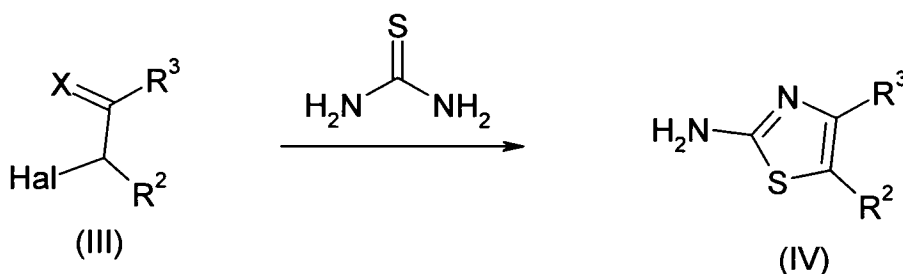
Bevorzugt werden aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie beispielsweise Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether (MTBE), Methyl-tert-amylether, Dioxan,

Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie beispielsweise Acetonitril, Propionitril, n- oder iso-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie beispielsweise N,N-Dimethylformamid (DMF), N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon (NMP) oder Hexamethylenphosphorsäuretriamid, Alkohole bei Verwendung von SO_2Cl_2 , wie
 5 beispielsweise Methanol, Ethanol oder Mischungen dieser verwendet.

Die Reaktion kann im Vakuum, bei Normaldruck oder unter Überdruck und bei Temperaturen von -20 bis 200 °C durchgeführt werden, vorzugsweise erfolgt die Reaktion bei Normaldruck und Temperaturen von 50 bis 150 °C.

Schritt (b) Synthese der 2-Aminothiazole der Formel (IV)

10 Die α -Halogenketone der Formel III werden mit Thioharnstoff zu den 2-Aminothiazolen der Formel (IV) umgesetzt.



Die Umsetzung der α -Halogenketone (III) mit dem Thioharnstoff kann in Substanz oder in einem Lösungsmittel erfolgen, vorzugsweise wird die Reaktion in einem Lösungsmittel durchgeführt,
 15 welches ausgewählt ist aus üblichen, bei den vorherrschenden Reaktionsbedingungen inerten Lösungsmitteln.

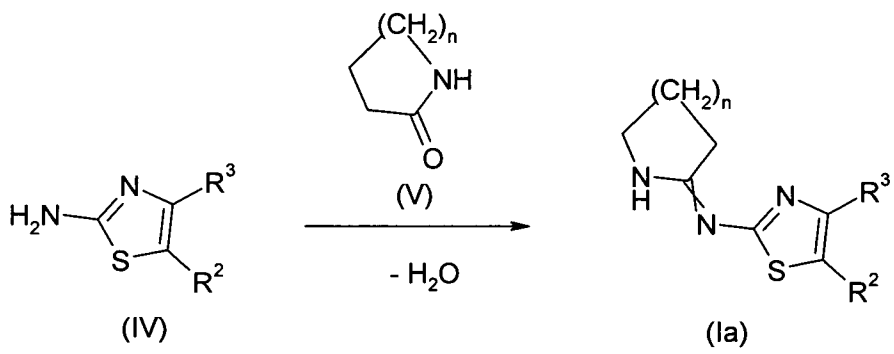
Bevorzugt werden aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan,
 20 Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie beispielsweise Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether (MTBE), Methyl-tert-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie beispielsweise Acetonitril, Propionitril, n- oder iso-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie beispielsweise N,N-Dimethylformamid (DMF), N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon
 25 (NMP) oder Hexamethylenphosphorsäuretriamid; oder Mischungen dieser mit Wasser sowie reines Wasser.

Die Reaktion kann im Vakuum, bei Normaldruck oder unter Überdruck und bei Temperaturen von -20 bis 200 °C durchgeführt werden, vorzugsweise erfolgt die Reaktion bei Normaldruck und Temperaturen von 50 bis 150 °C.

Geeignete Verfahren zur Herstellung von 2-Aminothiazolen sind im Stand der Technik, 5 beispielsweise durch T.M. Potewar et al in Tetrahedron 64 (2008) 5019-5022, vorbeschrieben.

Schritt (c) Umsetzung der 2-Aminothiazole der Formel (IV) mit Lactamen der Formel (V)

Die Umsetzung der 2-Aminothiazole der Formel (IV) mit Lactamen der Formel (V), wobei n die zuvor beschriebenen Bedeutungen hat, in Anwesenheit von geeigneten Kondensationsmitteln, führt 10 zu Verbindungen der Formel (Ia).



Geeignete Kondensationsmittel sind alle Reagenzien, die dem Reaktionsgemisch Wasser entziehen und somit das Gleichgewicht der Reaktion auf Seiten des Produkts (Ia) verschieben. Beispielfhaft seien Säurehalogenidbildner wie z.B. Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphor- 15 pentachlorid, Phosphortrichloridoxid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie z.B. Methylchlorformiat, Ethylchlorformiat, Isopropylchlorformiat, Isobutylchlorformiat oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimine wie z.B. N,N'-Dicyclohexylcarbodiimin (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel wie z.B. Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbodiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinolin (EEDQ), Triphenyl- 20 phosphin/Tetrachlormethan oder Bromtripyrrolidinophosphoniumhexafluorophosphat genannt. Besonders bevorzugt wird POCl₃ verwendet.

Die Reaktion gemäß Schritt (c) erfolgt vorzugsweise in einem Lösungsmittel, welches ausgewählt ist aus den üblichen, bei den vorherrschenden Reaktionsbedingungen inerten Lösungsmitteln. Bevorzugt werden aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispiels- 25 weise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie beispielsweise Di-

ethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether (MTBE), Methyl-tert-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol.

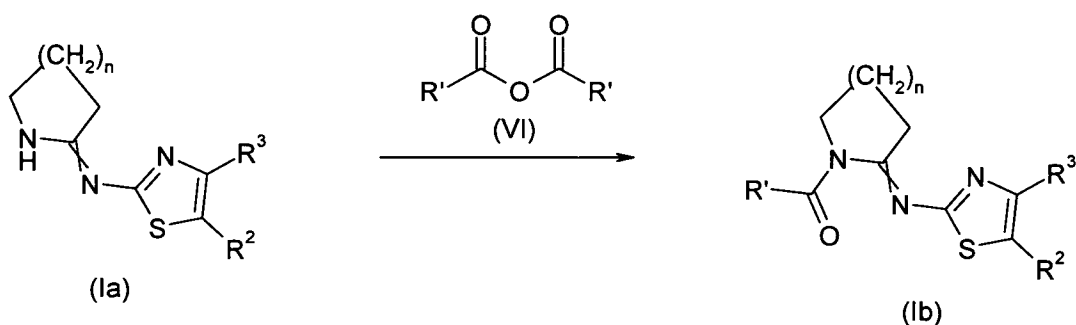
Die Reaktion kann im Vakuum, bei Normaldruck oder unter Überdruck und bei Temperaturen von -20 bis 200 °C durchgeführt werden, vorzugsweise erfolgt die Reaktion bei Normaldruck und

5 Temperaturen von 50 bis 150 °C.

Besonders bevorzugt werden Lactame der Formel (V) verwendet, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Pyrrolidon und Piperidon.

Schritt (d) Umsetzung von Verbindungen der Formel (Ia) mit Carbonsäureanhydriden der Formel (VI)

10 Die Umwandlung der N-H-Lactame der Formel (Ia) zu N-Acetyl-Lactamen der Formel (Ib) kann durch Umsetzung mit einem Carbonsäureanhydrid der Formel (VI) erfolgen.



Die Umsetzung der Verbindung (Ia) mit Carbonsäureanhydrid der Formel (VI) kann in Substanz oder in einem Lösungsmittel erfolgen, vorzugsweise wird die Reaktion in einem Lösungsmittel
15 durchgeführt, welches ausgewählt ist aus üblichen, bei den vorherrschenden Reaktionsbedingungen inerten Lösungsmitteln.

Bevorzugt werden aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan,
20 Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie beispielsweise Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether (MTBE), Methyl-tert-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie beispielsweise Acetonitril, Propionitril, n- oder iso-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie beispielsweise N,N-Dimethylformamid (DMF), N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon
25 (NMP) oder Hexamethylenphosphorsäuretriamid.

Die Reaktion kann im Vakuum, bei Normaldruck oder unter Überdruck und bei Temperaturen von -20 bis 200 °C durchgeführt werden, vorzugsweise erfolgt die Reaktion bei Normaldruck und Temperaturen von 50 bis 150 °C.

- Besonders bevorzugt werden Carbonsäureanhydride verwendet, die ausgewählt sind aus der
- 5 Gruppe bestehend aus Acetanhydrid und Propionsäureanhydrid.

Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen

Die erfindungsgemäßen Amidine weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi (Pilze) und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

10 Pflanzenschutz

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

- 15 Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Erkrankungen, hervorgerufen durch Erreger des Echten Mehltaus wie z.B.

Blumeria-Arten, wie beispielsweise Blumeria graminis;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

- 20 Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Uncinula-Arten, wie beispielsweise Uncinula necator;

Erkrankungen, hervorgerufen durch Erreger von Rostkrankheiten wie z.B.

Gymnosporangium-Arten, wie beispielsweise Gymnosporangium sabinae

Hemileia-Arten, wie beispielsweise Hemileia vastatrix;

- 25 Phakopsora-Arten, wie beispielsweise Phakopsora pachyrhizi und Phakopsora meibomia;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Erkrankungen, hervorgerufen durch Erreger der Gruppe der Oomyceten wie z.B.

Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

- 30 Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

- Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder *Pseudoperonospora cubensis*;
Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;
Blattfleckenkrankheiten und Blattwelken, hervorgerufen durch z.B.
- 5 Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria solani*;
Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora beticola*;
Cladosporium-Arten, wie beispielsweise *Cladosporium cucumerinum*;
Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
- 10 Colletotrichum-Arten, wie beispielsweise *Colletotrichum lindemuthianum*;
Cycloconium-Arten, wie beispielsweise *Cycloconium oleaginum*;
Diaporthe-Arten, wie beispielsweise *Diaporthe citri*;
Elsinoe-Arten, wie beispielsweise *Elsinoe fawcettii*;
Gloeosporium-Arten, wie beispielsweise *Gloeosporium laeticolor*;
- 15 Glomerella-Arten, wie beispielsweise *Glomerella cingulata*;
Guignardia-Arten, wie beispielsweise *Guignardia bidwelli*;
Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria maculans*;
Magnaporthe-Arten, wie beispielsweise *Magnaporthe grisea*;
Mycosphaerella-Arten, wie beispielsweise *Mycosphaerella graminicola* und *Mycosphaerella*
- 20 *fijiensis*;
Phaeosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Phaeosphaeria nodorum*;
Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres*;
Ramularia-Arten, wie beispielsweise *Ramularia collo-cygni*;
Rhynchosporium-Arten, wie beispielsweise *Rhynchosporium secalis*;
- 25 Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria apii*;
Typhula-Arten, wie beispielsweise *Typhula incarnata*;
Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
Wurzel- und Stengelkrankheiten, hervorgerufen durch z.B.
Corticium-Arten, wie beispielsweise *Corticium graminearum*;
- 30 Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium oxysporum*;
Gaeumannomyces-Arten, wie beispielsweise *Gaeumannomyces graminis*;
Rhizoctonia-Arten, wie beispielsweise *Rhizoctonia solani*;
Tapesia-Arten, wie beispielsweise *Tapesia acuformis*;
Thielaviopsis-Arten, wie beispielsweise *Thielaviopsis basicola*;
- 35 Ähren- und Rispenkrankheiten (inklusive Maiskolben), hervorgerufen durch z.B.
Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria* spp.;
Aspergillus-Arten, wie beispielsweise *Aspergillus flavus*;

- Cladosporium-Arten, wie beispielsweise *Cladosporium cladosporioides*;
Claviceps-Arten, wie beispielsweise *Claviceps purpurea*;
Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
Gibberella-Arten, wie beispielsweise *Gibberella zeae*;
- 5 Monographella-Arten, wie beispielsweise *Monographella nivalis*;
Erkrankungen, hervorgerufen durch Brandpilze wie z.B.
Sphacelotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphacelotheca reiliana*;
Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
Urocystis-Arten, wie beispielsweise *Urocystis occulta*;
- 10 Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda*;
Fruchtfäule hervorgerufen durch z.B.
Aspergillus-Arten, wie beispielsweise *Aspergillus flavus*;
Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
Penicillium-Arten, wie beispielsweise *Penicillium expansum* und *Penicillium purpurogenum*;
- 15 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
Verticillium-Arten, wie beispielsweise *Verticillium alboatrum*;
Samen- und bodenbürtige Fäulen und Welken, sowie Sämlingserkrankungen, hervorgerufen durch z.B.
Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicicola*
- 20 Aphanomyces-Arten, wie beispielsweise *Aphanomyces euteiches*
Ascochyta-Arten, wie beispielsweise *Ascochyta lentis*
Aspergillus-Arten, wie beispielsweise *Aspergillus flavus*
Cladosporium-Arten, wie beispielsweise *Cladosporium herbarum*
Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
- 25 (Konidienform: Drechslera, Bipolaris Syn: Helminthosporium);
Colletotrichum-Arten, wie beispielsweise *Colletotrichum coccodes*;
Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
Gibberella-Arten, wie beispielsweise *Gibberella zeae*;
Macrophomina-Arten, wie beispielsweise *Macrophomina phaseolina*
- 30 Monographella-Arten, wie beispielsweise *Monographella nivalis*;
Penicillium-Arten, wie beispielsweise *Penicillium expansum*
Phoma-Arten, wie beispielsweise *Phoma lingam*
Phomopsis-Arten, wie beispielsweise *Phomopsis sojae*;
Phytophthora Arten, wie beispielsweise *Phytophthora cactorum*;
- 35 Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora graminea*
Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;

- Rhizoctonia-Arten, wie beispielsweise *Rhizoctonia solani*;
 Rhizopus-Arten, wie beispielsweise *Rhizopus oryzae*
 Sclerotium-Arten, wie beispielsweise *Sclerotium rolfsii*;
 Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
 5 Typhula-Arten, wie beispielsweise *Typhula incarnata*;
 Verticillium-Arten, wie beispielsweise *Verticillium dahliae*
 Krebserkrankungen, Gallen und Hexenbesen, hervorgerufen durch z.B.
 Nectria-Arten, wie beispielsweise *Nectria galligena*;
 Welkeerkrankungen hervorgerufen durch z.B.
- 10 Monilinia-Arten, wie beispielsweise *Monilinia laxa*;
 Deformationen von Blättern, Blüten und Früchten, hervorgerufen durch z.B.
 Taphrina-Arten, wie beispielsweise *Taphrina deformans*;
 Degenerationserkrankungen holziger pflanzen, hervorgerufen durch z.B.
 Esca-Arten, wie beispielsweise *Phaeomoniella chlamydospora* und *Phaeoacremonium aleophilum*
 15 und *Fomitiporia mediterranea*;
 Blüten- und Samenerkrankungen, hervorgerufen durch z.B.
 Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
 Erkrankungen von Pflanzenknollen, hervorgerufen durch z.B.
 Rhizoctonia-Arten, wie beispielsweise *Rhizoctonia solani*;
- 20 Helminthosporium-Arten, wie beispielsweise *Helminthosporium solani*;
 Erkrankungen, hervorgerufen durch bakterielle Erreger wie z.B.
 Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
 Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
 Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
- 25 Bevorzugt können die folgenden Krankheiten von Soja-Bohnen bekämpft werden:
 Pilzkrankheiten an Blättern, Stängeln, Schoten und Samen verursacht durch z.B.

- Alternaria leaf spot (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), Anthracnose (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), Brown spot (*Septoria glycines*), Cercospora leaf spot
 30 and blight (*Cercospora kikuchii*), Choanephora leaf blight (*Choanephora infundibulifera trisporea* (Syn.)), Dactuliophora leaf spot (*Dactuliophora glycines*), Downy Mildew (*Peronospora manshurica*), Drechslera blight (*Drechslera glycini*), Frogeye Leaf spot (*Cercospora sojae*), Leptosphaerulina Leaf Spot (*Leptosphaerulina trifolii*), Phyllosticta Leaf Spot (*Phyllosticta sojaecola*), Pod and Stem Blight (*Phomopsis sojae*), Powdery Mildew (*Microsphaera diffusa*),
 35 Pyrenochaeta Leaf Spot (*Pyrenochaeta glycines*), Rhizoctonia Aerial, Foliage, and Web Blight (*Rhizoctonia solani*), Rust (*Phakopsora pachyrhizi*), Scab (*Sphaceloma glycines*), Stemphylium Leaf Blight (*Stemphylium botryosum*), Target Spot (*Corynespora cassiicola*)

Pilzkrankheiten an Wurzeln und der Stängelbasis verursacht durch z.B.

Black Root Rot (*Calonectria crotalariae*), Charcoal Rot (*Macrophomina phaseolina*), Fusarium Blight or Wilt, Root Rot, and Pod and Collar Rot (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), Mycoleptodiscus Root Rot (*Mycoleptodiscus terrestris*),
5 Neocosmospora (*Neocosmospora vasinfecta*), Pod and Stem Blight (*Diaporthe phaseolorum*), Stem Canker (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), Phytophthora Rot (*Phytophthora megasperma*), Brown Stem Rot (*Phialophora gregata*), Pythium Rot (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), Rhizoctonia Root Rot, Stem Decay, and Damping-Off (*Rhizoctonia solani*), Sclerotinia Stem Decay (*Sclerotinia sclerotiorum*),
10 Sclerotinia Southern Blight (*Sclerotinia rolfsii*), Thielaviopsis Root Rot (*Thielaviopsis basicola*).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

15 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien
20 und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraums nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im Allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

25 Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie z.B. gegen Puccinia-Arten und von Krankheiten im Wein-, Obst- und
30 Gemüseanbau, wie z.B. gegen Botrytis-, Venturia- oder Alternaria-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

- 5 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder
- 10 Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und
- 15 Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

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

Mycotoxine

- Darüber hinaus kann durch die erfindungsgemäße Behandlung der Mykotoxingehalt im Erntegut
- 25 und den daraus hergestellten Nahrungs- und Futtermitteln verringert werden. Besonders, aber nicht ausschließlich sind hierbei folgende Mykotoxine zu nennen: Deoxynivalenol (DON), Nivalenol, 15-Ac-DON, 3-Ac-DON, T2- und HT2- Toxin, Fumonisine, Zearalenon, Moniliformin, Fusarin, Diacetoxyscirpenol (DAS), Beauvericin, Enniatin, Fusaroproliferin, Fusarenol, Ochratoxine, Patulin, Mutterkornalkaloide und Aflatoxine, die beispielsweise von den folgenden Pilzen
- 30 verursacht werden können: *Fusarium spec.*, wie *Fusarium acuminatum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikuroi*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminearum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F.*

verticillioides u.a. sowie auch von *Aspergillus spec.*, *Penicillium spec.*, *Claviceps purpurea*, *Stachybotrys spec.* u.a.

Materialschutz

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen
5 Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz,
10 Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrich-
15 mittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen
20 Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

- Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,
- Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,
- Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,
- 25 Coniophora, wie *Coniophora puetana*,
- Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,
- Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,
- Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,
- Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,
- 30 Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,
- Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,
- Escherichia, wie *Escherichia coli*,
- Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,
- Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

Formulierungen

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Mittel zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, umfassend wenigstens eines der erfindungsgemäßen Isothiazolyloxyphenylamidine.

Die erfindungsgemäßen Isothiazolyloxyphenylamidine können dazu in Abhängigkeit von ihren
5 jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der
10 Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/ oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als
15 Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfractionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dime-
20 thylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthe-
25 tische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage:
30 z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl-polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthe-

tische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

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

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

10 Die zuvor beschriebenen Formulierungen können in einem erfindungsgemäßen Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen verwendet werden, bei dem die erfindungsgemäßen Isothiazolyloxyphenylamidine auf die Mikroorganismen und/oder in deren Lebensraum ausgebracht werden.

Saatgutbehandlung

15 Die Bekämpfung von phytopathogenen Pilzen durch die Behandlung des Saatguts von Pflanzen ist seit langem bekannt und ist Gegenstand ständiger Verbesserungen. Dennoch ergeben sich bei der Behandlung von Saatgut eine Reihe von Problemen, die nicht immer zufrieden stellend gelöst werden können. So ist es erstrebenswert, Verfahren zum Schutz des Saatguts und der keimenden Pflanze zu entwickeln, die das zusätzliche Ausbringen von Pflanzenschutzmitteln nach der Saat
20 oder nach dem Auflaufen der Pflanzen überflüssig machen oder zumindest deutlich verringern. Es ist weiterhin erstrebenswert, die Menge des eingesetzten Wirkstoffs dahingehend zu optimieren, dass das Saatgut und die keimende Pflanze vor dem Befall durch phytopathogene Pilze bestmöglich geschützt werden, ohne jedoch die Pflanze selbst durch den eingesetzten Wirkstoff zu schädigen. Insbesondere sollten Verfahren zur Behandlung von Saatgut auch die intrinsischen
25 fungiziden Eigenschaften transgener Pflanzen einbeziehen, um einen optimalen Schutz des Saatguts und der keimenden Pflanze bei einem minimalen Aufwand an Pflanzenschutzmitteln zu erreichen.

Die vorliegende Erfindung bezieht sich daher insbesondere auch auf ein Verfahren zum Schutz von Saatgut und keimenden Pflanzen vor dem Befall von phytopathogenen Pilzen, indem das Saatgut
30 mit einem erfindungsgemäßen Mittel behandelt wird.

Die Erfindung bezieht sich ebenfalls auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Mittel zur Behandlung von Saatgut zum Schutz des Saatguts und der keimenden Pflanze vor phytopathogenen Pilzen.

Weiterhin bezieht sich die Erfindung auf Saatgut, welches zum Schutz vor phytopathogenen Pilzen
5 mit einem erfindungsgemäßen Mittel behandelt wurde.

Einer der Vorteile der vorliegenden Erfindung ist es, dass aufgrund der besonderen systemischen Eigenschaften der erfindungsgemäßen Mittel die Behandlung des Saatguts mit diesen Mitteln nicht nur das Saatgut selbst, sondern auch die daraus hervorgehenden Pflanzen nach dem Auflaufen vor phytopathogenen Pilzen schützt. Auf diese Weise kann die unmittelbare Behandlung der Kultur
10 zum Zeitpunkt der Aussaat oder kurz danach entfallen.

Ebenso ist es als vorteilhaft anzusehen, dass die erfindungsgemäßen Mischungen insbesondere auch bei transgenem Saatgut eingesetzt werden können.

Die erfindungsgemäßen Mittel eignen sich zum Schutz von Saatgut jeglicher Pflanzensorte, die in der Landwirtschaft, im Gewächshaus, in Forsten oder im Gartenbau eingesetzt wird. Insbesondere
15 handelt es sich dabei um Saatgut von Getreide (wie Weizen, Gerste, Roggen, Hirse und Hafer), Mais, Baumwolle, Soja, Reis, Kartoffeln, Sonnenblume, Bohne, Kaffee, Rübe (z.B. Zuckerrübe und Futterrübe), Erdnuss, Gemüse (wie Tomate, Gurke, Zwiebeln und Salat), Rasen und Zierpflanzen. Besondere Bedeutung kommt der Behandlung des Saatguts von Getreide (wie Weizen, Gerste, Roggen und Hafer), Mais und Reis zu.

20 Im Rahmen der vorliegenden Erfindung wird das erfindungsgemäße Mittel alleine oder in einer geeigneten Formulierung auf das Saatgut aufgebracht. Vorzugsweise wird das Saatgut in einem Zustand behandelt, in dem so stabil ist, dass keine Schäden bei der Behandlung auftreten. Im Allgemeinen kann die Behandlung des Saatguts zu jedem Zeitpunkt zwischen der Ernte und der Aussaat erfolgen. Üblicherweise wird Saatgut verwendet, das von der Pflanze getrennt und von Kolben,
25 Schalen, Stängeln, Hülle, Wolle oder Fruchtfleisch befreit wurde. So kann zum Beispiel Saatgut verwendet werden, das geerntet, gereinigt und bis zu einem Feuchtigkeitsgehalt von unter 15 Gew.-% getrocknet wurde. Alternativ kann auch Saatgut verwendet werden, das nach dem Trocknen z.B. mit Wasser behandelt und dann erneut getrocknet wurde.

Im Allgemeinen muss bei der Behandlung des Saatguts darauf geachtet werden, dass die Menge
30 des auf das Saatgut aufgetragenen erfindungsgemäßen Mittels und/oder weiterer Zusatzstoffe so gewählt wird, dass die Keimung des Saatguts nicht beeinträchtigt bzw. die daraus hervorgehende Pflanze nicht geschädigt wird. Dies ist vor allem bei Wirkstoffen zu beachten, die in bestimmten Aufwandmengen phytotoxische Effekte zeigen können.

Die erfindungsgemäßen Mittel können unmittelbar aufgebracht werden, also ohne weitere Komponenten zu enthalten und ohne verdünnt worden zu sein. In der Regel ist es vorzuziehen, die Mittel in Form einer geeigneten Formulierung auf das Saatgut aufzubringen. Geeignete Formulierungen und Verfahren für die Saatgutbehandlung sind dem Fachmann bekannt und werden z.B. in den folgenden Dokumenten beschrieben: US 4,272,417 A, US 4,245,432 A, US 4,808,430 A, US 5,876,739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

Die erfindungsgemäß verwendbaren Wirkstoffkombinationen können in die üblichen Beizmittel-Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Slurries oder andere Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Formulierungen.

10 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, indem man die Wirkstoffe oder Wirkstoffkombinationen mit üblichen Zusatzstoffen vermischt, wie zum Beispiel übliche Streckmittel sowie Lösungs- oder Verdünnungsmittel, Farbstoffe, Netzmittel, Dispergiermittel, Emulgatoren, Entschäumer, Konservierungsmittel, sekundäre Verdickungsmittel, Kleber, Gibberelline und auch Wasser.

15 Als Farbstoffe, die in den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen enthalten sein können, kommen alle für derartige Zwecke üblichen Farbstoffe in Betracht. Dabei sind sowohl in Wasser wenig lösliche Pigmente als auch in Wasser lösliche Farbstoffe verwendbar. Als Beispiele genannt seien die unter den Bezeichnungen Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 und C.I. Solvent Red 1 bekannten Farbstoffe.

20 Als Netzmittel, die in den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen enthalten sein können, kommen alle zur Formulierung von agrochemischen Wirkstoffen üblichen, die Benetzung fördernden Stoffe in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkyl-naphthalin-Sulfonate, wie Diisopropyl- oder Diisobutyl-naphthalin-Sulfonate.

Als Dispergiermittel und/oder Emulgatoren, die in den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-
25 Formulierungen enthalten sein können, kommen alle zur Formulierung von agrochemischen Wirkstoffen üblichen nichtionischen, anionischen und kationischen Dispergiermittel in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind nichtionische oder anionische Dispergiermittel oder Gemische von nichtionischen oder anionischen Dispergiermitteln. Als geeignete nichtionische Dispergiermittel sind insbesondere Ethylenoxid-Propylenoxid Blockpolymere, Alkylphenolpolyglykolether sowie
30 Tristerylphenolpolyglykolether und deren phosphatierte oder sulfatierte Derivate zu nennen. Geeignete anionische Dispergiermittel sind insbesondere Ligninsulfonate, Polyacrylsäuresalze und Arylsulfonat-Formaldehydkondensate.

Als Entschäumer können in den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen alle zur Formulierung von agrochemischen Wirkstoffen üblichen schaumhemmenden Stoffe enthalten sein. Vorzugsweise verwendbar sind Silikonentschäumer und Magnesiumstearat.

Als Konservierungsmittel können in den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen alle für derartige Zwecke in agrochemischen Mitteln einsetzbaren Stoffe vorhanden sein. Beispielfhaft genannt seien Dichlorophen und Benzylalkoholhemiformal.

Als sekundäre Verdickungsmittel, die in den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen enthalten sein können, kommen alle für derartige Zwecke in agrochemischen Mitteln einsetzbaren Stoffe in Frage. Vorzugsweise in Betracht kommen Cellulosederivate, Acrylsäurederivate, Xanthan, modifizierte Tone und hochdisperse Kieselsäure.

Als Kleber, die in den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen enthalten sein können, kommen alle üblichen in Beizmitteln einsetzbaren Bindemittel in Frage. Vorzugsweise genannt seien Polyvinylpyrrolidon, Polyvinylacetat, Polyvinylalkohol und Tylose.

Als Gibberelline, die in den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen enthalten sein können, kommen vorzugsweise die Gibberelline A1, A3 (= Gibberellinsäure), A4 und A7 infrage, besonders bevorzugt verwendet man die Gibberellinsäure. Die Gibberelline sind bekannt (vgl. R. Wegler „Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel“, Bd. 2, Springer Verlag, 1970, S. 401-412).

Die erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen können entweder direkt oder nach vorherigem Verdünnen mit Wasser zur Behandlung von Saatgut der verschiedensten Art eingesetzt werden. So lassen sich die Konzentrate oder die daraus durch Verdünnen mit Wasser erhältlichen Zubereitungen einsetzen zur Beizung des Saatgutes von Getreide, wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer und Triticale, sowie des Saatgutes von Mais, Reis, Raps, Erbsen, Bohnen, Baumwolle, Sonnenblumen und Rüben oder auch von Gemüsesaatgut der verschiedensten Natur. Die erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen oder deren verdünnte Zubereitungen können auch zum Beizen von Saatgut transgener Pflanzen eingesetzt werden. Dabei können im Zusammenwirken mit den durch Expression gebildeten Substanzen auch zusätzliche synergistische Effekte auftreten.

Zur Behandlung von Saatgut mit den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen oder den daraus durch Zugabe von Wasser hergestellten Zubereitungen kommen alle üblicherweise für die Beizung einsetzbaren Mischgeräte in Betracht. Im einzelnen geht man bei der Beizung so vor, dass man das Saatgut in einen Mischer gibt, die jeweils gewünschte Menge an Beizmittel-Formulierungen entweder als solche oder nach vorherigem Verdünnen mit Wasser hinzufügt und bis

zur gleichmäßigen Verteilung der Formulierung auf dem Saatgut mischt. Gegebenenfalls schließt sich ein Trocknungsvorgang an.

Die Aufwandmenge an den erfindungsgemäß verwendbaren Beizmittel-Formulierungen kann innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Sie richtet sich nach dem jeweiligen Gehalt der Wirkstoffe in den Formulierungen und nach dem Saatgut. Die Aufwandmengen an Wirkstoffkombination liegen im Allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 15 g pro Kilogramm Saatgut.

Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden

Die erfindungsgemäßen Amidine können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Aminothiazole der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die erfindungsgemäßen Isothiazolyloxyphenylamidine können daher sowohl in medizinische als auch in nicht-medizinische Anwendungen eingesetzt werden.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren.

Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Isothiazolyloxyphenylamidine als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im Allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

GMOs

Das erfindungsgemäße Behandlungsverfahren kann für die Behandlung von genetisch modifizierten Organismen (GMOs), z. B. Pflanzen oder Samen, verwendet werden. Genetisch modifizierte Pflanzen (oder transgene Pflanzen) sind Pflanzen, bei denen ein heterologes Gen stabil in das Genom integriert worden ist. Der Begriff "heterologes Gen" bedeutet im wesentlichen ein Gen, das außerhalb der Pflanze bereitgestellt oder assembliert wird und das bei Einführung in das Zellkerngenom, das Chloroplastengenom oder das Mitochondriengenom der transformierten Pflanze dadurch neue oder verbesserte agronomische oder sonstige Eigenschaften verleiht, daß es ein interessierendes Protein oder Polypeptid exprimiert oder daß es ein anderes Gen, das in der Pflanze vorliegt bzw. andere Gene, die in der Pflanze vorliegen, herunterreguliert oder abschaltet (zum Beispiel mittels Antisense-Technologie, Cosuppressionstechnologie oder RNAi-Technologie [RNA Interference]). Ein heterologes Gen, das im Genom vorliegt, wird ebenfalls als Transgen bezeichnet. Ein Transgen, das durch sein spezifisches Vorliegen im Pflanzengenom definiert ist, wird als Transformations- bzw. transgenes Event bezeichnet.

In Abhängigkeit von den Pflanzenarten oder Pflanzensorten, ihrem Standort und ihren Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) kann die erfindungsgemäße Behandlung auch zu überadditiven ("synergistischen") Effekten führen. So sind zum Beispiel die folgenden Effekte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen: verringerte Aufwandmengen und/oder erweitertes Wirkungsspektrum und/oder erhöhte Wirksamkeit der Wirkstoffe und Zusammensetzungen, die erfindungsgemäß eingesetzt werden können, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegenüber Trockenheit oder Wasser- oder Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, Ernteerleichterung, Reifebeschleunigung, höhere Erträge, größere Früchte, größere Pflanzenhöhe, intensiver grüne Farbe des Blatts, frühere Blüte, höhere Qualität und/oder höherer Nährwert der Ernteprodukte, höhere Zuckerkonzentration in den Früchten, bessere Lagerfähigkeit und/oder Verarbeitbarkeit der Ernteprodukte.

In gewissen Aufwandmengen können die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen auch eine stärkende Wirkung auf Pflanzen ausüben. Sie eignen sich daher für die Mobilisierung des pflanzlichen Abwehrsystems gegen Angriff durch unerwünschte phytopathogene Pilze und/oder Mikroorganismen und/oder Viren. Dies kann gegebenenfalls einer der Gründe für die erhöhte

5 Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Kombinationen sein, zum Beispiel gegen Pilze. Pflanzenstärkende (resistenzinduzierende) Substanzen sollen im vorliegenden Zusammenhang auch solche Substanzen oder Substanzkombinationen bedeuten, die fähig sind, das pflanzliche Abwehrsystem so zu stimulieren, daß die behandelten Pflanzen, wenn sie im Anschluß daran mit unerwünschten phytopathogenen Pilzen und/oder Mikroorganismen und/oder Viren inokkuliert

10 werde, einen beträchtlichen Resistenzgrad gegen diese unerwünschten phytopathogenen Pilze und/oder Mikroorganismen und/oder Viren aufweisen. Im vorliegenden Fall versteht man unter unerwünschten phytopathogenen Pilzen und/oder Mikroorganismen und/oder Viren phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren. Die erfindungsgemäßen Substanzen lassen sich daher zum Schutz von Pflanzen gegen Angriff durch die erwähnten Pathogene innerhalb eines gewissen

15 Zeitraums nach der Behandlung einsetzen. Der Zeitraum, über den eine Schutzwirkung erzielt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tagen, vorzugsweise 1 bis 7 Tagen, nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Zu Pflanzen und Pflanzensorten, die vorzugsweise erfindungsgemäß behandelt werden, zählen alle Pflanzen, die über Erbgut verfügen, das diesen Pflanzen besonders vorteilhafte, nützliche

20 Merkmale verleiht (egal, ob dies durch Züchtung und/oder Biotechnologie erzielt wurde).

Pflanzen und Pflanzensorten, die ebenfalls vorzugsweise erfindungsgemäß behandelt werden, sind gegen einen oder mehrere biotische Streßfaktoren resistent, d. h. diese Pflanzen weisen eine verbesserte Abwehr gegen tierische und mikrobielle Schädlinge wie Nematoden, Insekten, Milben, phytopathogene Pilze, Bakterien, Viren und/oder Viroide auf.

25 Pflanzen und Pflanzensorten, die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind solche Pflanzen, die gegen einen oder mehrere abiotische Streßfaktoren resistent sind. Zu den abiotischen Streßbedingungen können zum Beispiel Dürre, Kälte- und Hitzebedingungen, osmotischer Streß, Staunässe, erhöhter Bodensalzgehalt, erhöhtes Ausgesetztsein an Mineralien, Ozonbedingungen, Starklichtbedingungen, beschränkte Verfügbarkeit von Stickstoffnährstoffen, beschränkte

30 Verfügbarkeit von Phosphornährstoffen oder Vermeidung von Schatten zählen.

Pflanzen und Pflanzensorten, die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind solche Pflanzen, die durch erhöhte Ertrageigenschaften gekennzeichnet sind. Ein erhöhter Ertrag kann bei diesen Pflanzen z. B. auf verbesserter Pflanzenphysiologie, verbessertem Pflanzenwuchs und verbesserter Pflanzenentwicklung, wie Wasserverwertungseffizienz, Wasserhalteeffizienz,

verbesserter Stickstoffverwertung, erhöhter Kohlenstoffassimilation, verbesserter Photosynthese, verstärkter Keimkraft und beschleunigter Abreife beruhen. Der Ertrag kann weiterhin durch eine verbesserte Pflanzenarchitektur (unter Streß- und nicht-Streß-Bedingungen) beeinflusst werden, darunter frühe Blüte, Kontrolle der Blüte für die Produktion von Hybridsaatgut, 5 Keimpflanzenwüchsigkeit, Pflanzengröße, Internodienzahl und -abstand, Wurzelwachstum, Samengröße, Fruchtgröße, Schotengröße, Schoten- oder Ährenzahl, Anzahl der Samen pro Schote oder Ähre, Samenmasse, verstärkte Samenfüllung, verringerter Samenausfall, verringertes Schotenplatzen sowie Standfestigkeit. Zu weiteren Ertragsmerkmalen zählen Samenzusammensetzung wie Kohlenhydratgehalt, Proteingehalt, Ölgehalt und 10 Ölzusammensetzung, Nährwert, Verringerung der nährwidrigen Verbindungen, verbesserte Verarbeitbarkeit und verbesserte Lagerfähigkeit.

Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Hybridpflanzen, die bereits die Eigenschaften der Heterosis bzw. des Hybrideffekts exprimieren, was im allgemeinen zu höherem Ertrag, höherer Wüchsigkeit, besserer Gesundheit und besserer Resistenz gegen biotische und 15 abiotische Streßfaktoren führt. Solche Pflanzen werden typischerweise dadurch erzeugt, daß man eine ingezüchtete pollensterile Elternlinie (den weiblichen Kreuzungspartner) mit einer anderen ingezüchteten pollenfertilen Elternlinie (dem männlichen Kreuzungspartner) kreuzt. Das Hybridsaatgut wird typischerweise von den pollensterilen Pflanzen geerntet und an Vermehrer verkauft. Pollensterile Pflanzen können manchmal (z. B. beim Mais) durch Entfahnen (d. h. 20 mechanischem Entfernen der männlichen Geschlechtsorgane bzw. der männlichen Blüten), produziert werden; es ist jedoch üblicher, daß die Pollensterilität auf genetischen Determinanten im Pflanzengenom beruht. In diesem Fall, insbesondere dann, wenn es sich bei dem gewünschten Produkt, das man von den Hybridpflanzen ernten will, um die Samen handelt, ist es üblicherweise günstig, sicherzustellen, daß die Pollenfertilität in Hybridpflanzen, die die für die Pollensterilität 25 verantwortlichen genetischen Determinanten enthalten, völlig restoriert wird. Dies kann erreicht werden, indem sichergestellt wird, daß die männlichen Kreuzungspartner entsprechende Fertilitätsrestorgene besitzen, die in der Lage sind, die Pollenfertilität in Hybridpflanzen, die die genetischen Determinanten, die für die Pollensterilität verantwortlich sind, enthalten, zu restorieren. Genetische Determinanten für Pollensterilität können im Cytoplasma lokalisiert sein. 30 Beispiele für cytoplasmatische Pollensterilität (CMS) wurden zum Beispiel für Brassica-Arten beschrieben. Genetische Determinanten für Pollensterilität können jedoch auch im Zellkerngenom lokalisiert sein. Pollensterile Pflanzen können auch mit Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie Gentechnik, erhalten werden. Ein besonders günstiges Mittel zur Erzeugung von pollensterilen Pflanzen ist in WO 89/10396 beschrieben, wobei zum Beispiel eine Ribonuklease wie eine Barnase 35 selektiv in den Tapetumzellen in den Staubblättern exprimiert wird. Die Fertilität kann dann durch Expression eines Ribonukleasehemmers wie Barstar in den Tapetumzellen restoriert werden.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die mit Methoden der Pflanzenbiotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten werden), die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind herbizidtolerante Pflanzen, d. h. Pflanzen, die gegenüber einem oder mehreren vorgegebenen Herbiziden tolerant gemacht worden sind. Solche Pflanzen können entweder durch genetische Transformation oder durch
5 Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine Herbizidtoleranz verleiht, erhalten werden.

Herbizidtolerante Pflanzen sind zum Beispiel glyphosatetolerante Pflanzen, d. h. Pflanzen, die gegenüber dem Herbizid Glyphosate oder dessen Salzen tolerant gemacht worden sind. So können zum Beispiel glyphosatetolerante Pflanzen durch Transformation der Pflanze mit einem Gen, das
10 für das Enzym 5-Enolpyruvylshikimat-3-phosphatsynthase (EPSPS) kodiert, erhalten werden. Beispiele für solche EPSPS-Gene sind das AroA-Gen (Mutante CT7) des Bakterium *Salmonella typhimurium*, das CP4-Gen des Bakteriums *Agrobacterium sp.*, die Gene, die für eine EPSPS aus der Petunie, für eine EPSPS aus der Tomate oder für eine EPSPS aus Eleusine kodieren. Es kann sich auch um eine mutierte EPSPS handeln. Glyphosatetolerante Pflanzen können auch dadurch
15 erhalten werden, daß man ein Gen exprimiert, das für ein Glyphosate-Oxidoreduktase-Enzym kodiert. Glyphosatetolerante Pflanzen können auch dadurch erhalten werden, daß man ein Gen exprimiert, das für ein Glyphosate-acetyltransferase-Enzym kodiert. Glyphosatetolerante Pflanzen können auch dadurch erhalten werden, daß man Pflanzen, die natürlich vorkommende Mutationen der oben erwähnten Gene selektiert.

20 Sonstige herbizidresistente Pflanzen sind zum Beispiel Pflanzen, die gegenüber Herbiziden, die das Enzym Glutaminsynthase hemmen, wie Bialaphos, Phosphinothricin oder Glufosinate, tolerant gemacht worden sind. Solche Pflanzen können dadurch erhalten werden, daß man ein Enzym exprimiert, das das Herbizid oder eine Mutante des Enzyms Glutaminsynthase, das gegenüber Hemmung resistent ist, entgiftet. Solch ein wirksames entgiftendes Enzym ist zum Beispiel ein
25 Enzym, das für ein Phosphinothricin-acetyltransferase kodiert (wie zum Beispiel das bar- oder pat-Protein aus Streptomyces-Arten). Pflanzen, die eine exogene Phosphinothricin-acetyltransferase exprimieren, sind beschrieben.

Weitere herbizidtolerante Pflanzen sind auch Pflanzen, die gegenüber den Herbiziden, die das Enzym Hydroxyphenylpyruvatdioxygenase (HPPD) hemmen, tolerant gemacht worden sind. Bei
30 den Hydroxyphenylpyruvatdioxygenasen handelt es sich um Enzyme, die die Reaktion, in der para-Hydroxyphenylpyruvat (HPP) zu Homogentisat umgesetzt wird, katalysieren. Pflanzen, die gegenüber HPPD-Hemmern tolerant sind, können mit einem Gen, das für ein natürlich vorkommendes resistentes HPPD-Enzym kodiert, oder einem Gen, das für ein mutiertes HPPD-Enzym kodiert, transformiert werden. Eine Toleranz gegenüber HPPD-Hemmern kann auch
35 dadurch erzielt werden, daß man Pflanzen mit Genen transformiert, die für gewisse Enzyme

kodieren, die die Bildung von Homogentisat trotz Hemmung des nativen HPPD-Enzyms durch den HPPD-Hemmer ermöglichen. Die Toleranz von Pflanzen gegenüber HPPD-Hemmern kann auch dadurch verbessert werden, daß man Pflanzen zusätzlich zu einem Gen, das für ein HPPD-tolerantes Enzym kodiert, mit einem Gen transformiert, das für ein Prephenatdehydrogenase-Enzym kodiert.

Weitere herbizidresistente Pflanzen sind Pflanzen, die gegenüber Acetolactatsynthase (ALS)-Hemmern tolerant gemacht worden sind. Zu bekannten ALS-Hemmern zählen zum Beispiel Sulfonylharnstoff, Imidazolinon, Triazolopyrimidine, Pyrimidinyloxy(thio)benzoate und/oder Sulfonylaminocarbonyltriazolinon-Herbizide. Es ist bekannt, daß verschiedene Mutationen im Enzym ALS (auch als Acetohydroxysäure-Synthase, AHAS, bekannt) eine Toleranz gegenüber unterschiedlichen Herbiziden bzw. Gruppen von Herbiziden verleihen. Die Herstellung von sulfonylharnstofftoleranten Pflanzen und imidazolinontoleranten Pflanzen ist in der internationalen Veröffentlichung WO 1996/033270 beschrieben. Weitere sulfonylharnstoff- und imidazolinontolerante Pflanzen sind auch in z.B. WO 2007/024782 beschrieben.

Weitere Pflanzen, die gegenüber Imidazolinon und/oder Sulfonylharnstoff tolerant sind, können durch induzierte Mutagenese, Selektion in Zellkulturen in Gegenwart des Herbizids oder durch Mutationszüchtung erhalten werden.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind insektenresistente transgene Pflanzen, d.h. Pflanzen, die gegen Befall mit gewissen Zielinsekten resistent gemacht wurden. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine Insektenresistenz verleiht, erhalten werden.

Der Begriff "insektenresistente transgene Pflanze" umfaßt im vorliegenden Zusammenhang jegliche Pflanze, die mindestens ein Transgen enthält, das eine Kodiersequenz umfaßt, die für folgendes kodiert:

- 1) ein insektizides Kristallprotein aus *Bacillus thuringiensis* oder einen insektiziden Teil davon, wie die insektiziden Kristallproteine, die online bei: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/ beschrieben sind, zusammengestellt wurden, oder insektizide Teile davon, z.B. Proteine der Cry-Proteinklassen Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae oder Cry3Bb oder insektizide Teile davon; oder

- 2) ein Kristallprotein aus *Bacillus thuringiensis* oder einen Teil davon, der in Gegenwart eines zweiten, anderen Kristallproteins als *Bacillus thuringiensis* oder eines Teils davon insektizid wirkt, wie das binäre Toxin, das aus den Kristallproteinen Cy34 und Cy35 besteht; oder
- 5 3) ein insektizides Hybridprotein, das Teile von zwei unterschiedlichen insektiziden Kristallproteinen aus *Bacillus thuringiensis* umfaßt, wie zum Beispiel ein Hybrid aus den Proteinen von 1) oben oder ein Hybrid aus den Proteinen von 2) oben, z. B. das Protein Cry1A.105, das von dem Mais-Event MON98034 produziert wird (WO 2007/027777); oder
- 10 4) ein Protein gemäß einem der Punkte 1) bis 3) oben, in dem einige, insbesondere 1 bis 10, Aminosäuren durch eine andere Aminosäure ersetzt wurden, um eine höhere insektizide Wirksamkeit gegenüber einer Zielinsektenart zu erzielen und/oder um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern und/oder wegen Veränderungen, die in die Kodier- DNA während der Klonierung oder Transformation induziert wurden, wie
- 15 das Protein Cry3Bb1 in Mais-Events MON863 oder MON88017 oder das Protein Cry3A im Mais-Event MIR 604;
- 5) ein insektizides sezerniertes Protein aus *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus* oder einen insektiziden Teil davon, wie die vegetativ wirkenden insektentoxischen Proteine (vegetative insecticidal proteins, VIP), die unter
- 20 http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html angeführt sind, z. B. Proteine der Proteinklasse VIP3Aa; oder
- 6) ein sezerniertes Protein aus *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus*, das in Gegenwart eines zweiten sezernierten Proteins aus *Bacillus thuringiensis* oder *B. cereus* insektizid wirkt, wie das binäre Toxin, das aus den Proteinen VIP1A und VIP2A besteht.
- 25 7) ein insektizides Hybridprotein, das Teile von verschiedenen sezernierten Proteinen von *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus* umfaßt, wie ein Hybrid der Proteine von 1) oder ein Hybrid der Proteine von 2) oben; oder
- 8) ein Protein gemäß einem der Punkte 1) bis 3) oben, in dem einige, insbesondere 1 bis 10, Aminosäuren durch eine andere Aminosäure ersetzt wurden, um eine höhere insektizide
- 30 Wirksamkeit gegenüber einer Zielinsektenart zu erzielen und/oder um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern und/oder wegen Veränderungen, die in die Kodier- DNA während der Klonierung oder Transformation induziert wurden (wobei

die Kodierung für ein insektizides Protein erhalten bleibt), wie das Protein VIP3Aa im Baumwoll-Event COT 102.

Natürlich zählt zu den insektenresistenten transgenen Pflanzen im vorliegenden Zusammenhang auch jegliche Pflanze, die eine Kombination von Genen umfaßt, die für die Proteine von einer der
5 oben genannten Klassen 1 bis 8 kodieren. In einer Ausführungsform enthält eine insektenresistente Pflanze mehr als ein Transgen, das für ein Protein nach einer der oben genannten 1 bis 8 kodiert, um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern oder um die Entwicklung einer Resistenz der Insekten gegen die Pflanzen dadurch hinauszuzögern, daß man verschiedene Proteine einsetzt, die für dieselbe Zielinsektenart insektizid sind, jedoch eine unterschiedliche
10 Wirkungsweise, wie Bindung an unterschiedliche Rezeptorbindungsstellen im Insekt, aufweisen.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind gegenüber abiotischen Streßfaktoren tolerant. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine
15 Streßresistenz verleiht, erhalten werden. Zu besonders nützlichen Pflanzen mit Streßtoleranz zählen folgende:

- a. Pflanzen, die ein Transgen enthalten, das die Expression und/oder Aktivität des Gens für die Poly(ADP-ribose)polymerase (PARP) in den Pflanzenzellen oder Pflanzen zu reduzieren vermag.
- 20 b. Pflanzen, die ein streßtoleranzförderndes Transgen enthalten, das die Expression und/oder Aktivität der für PARP kodierenden Gene der Pflanzen oder Pflanzenzellen zu reduzieren vermag;
- c. Pflanzen, die ein streßtoleranzförderndes Transgen enthalten, das für ein in Pflanzen funktionelles Enzym des Nicotinamidadenindinukleotid-Salvage-Biosynthesewegs kodiert,
25 darunter Nicotinamidase, Nicotinatphosphoribosyltransferase, Nicotinsäuremononukleotidadenyltransferase, Nicotinamidadenindinukleotidsynthetase oder Nicotinamidphosphoribosyltransferase.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, weisen
30 eine veränderte Menge, Qualität und/oder Lagerfähigkeit des Ernteprodukts und/oder veränderte Eigenschaften von bestimmten Bestandteilen des Ernteprodukts auf, wie zum Beispiel:

- 5 1) Transgene Pflanzen, die eine modifizierte Stärke synthetisieren, die bezüglich ihrer chemisch-physikalischen Eigenschaften, insbesondere des Amylosegehalts oder des Amylose/Amylopektin-Verhältnisses, des Verzweigungsgrads, der durchschnittlichen Kettenlänge, der Verteilung der Seitenketten, des Viskositätsverhaltens, der Gelfestigkeit, der Stärkekorngröße und/oder Stärkekornmorphologie im Vergleich mit der synthetisierten Stärke in Wildtypfpflanzenzellen oder -pflanzen verändert ist, so daß sich diese modifizierte Stärke besser für bestimmte Anwendungen eignet.
- 10 2) Transgene Pflanzen, die Nichtstärkekohlenhydratpolymere synthetisieren, oder Nichtstärkekohlenhydratpolymere, deren Eigenschaften im Vergleich zu Wildtypfpflanzen ohne genetische Modifikation verändert sind. Beispiele sind Pflanzen, die Polyfructose, insbesondere des Inulin- und Levantyps, produzieren, Pflanzen, die alpha-1,4-Glucane produzieren, Pflanzen, die alpha-1,6-verzweigte alpha-1,4-Glucane produzieren und Pflanzen, die Alternan produzieren.
- 3) Transgene Pflanzen, die Hyaluronan produzieren.
- 15 Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit veränderten Fasereigenschaften. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solche veränderten Fasereigenschaften verleiht, erhalten werden; dazu zählen:
- 20 a) Pflanzen wie Baumwollpflanzen, die eine veränderte Form von Cellulosesynthasegenen enthalten,
- b) Pflanzen wie Baumwollpflanzen, die eine veränderte Form von rsw2- oder rsw3-homologen Nukleinsäuren enthalten;
- c) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit einer erhöhten Expression der
25 Saccharosephosphatsynthase;
- d) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit einer erhöhten Expression der Saccharosesynthase;
- e) Pflanzen wie Baumwollpflanzen bei denen der Zeitpunkt der Durchlaßsteuerung der Plasmodesmen an der Basis der Faserzelle verändert ist, z. B. durch Herunterregulieren der faserselektiven β -1,3-Glucanase;

- f) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit Fasern mit veränderter Reaktivität, z. B. durch Expression des N-Acetylglucosamintransferasegens, darunter auch *nodC*, und von Chitinsynthasegenen.

Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen wie Raps oder verwandte Brassica-Pflanzen mit veränderten Eigenschaften der Ölzusammensetzung. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solche veränderten Öleigenschaften verleiht, erhalten werden; dazu zählen:

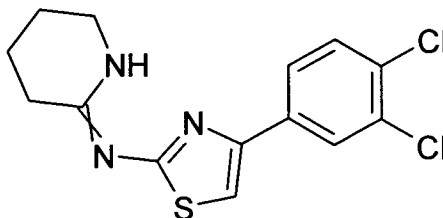
- 10 a) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem hohen Ölsäuregehalt produziere;
- b) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem niedrigen Linolensäuregehalt produzieren.
- c) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem niedrigen gesättigten Fettsäuregehalt produzieren.

Besonders nützliche transgene Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen mit einem oder mehreren Genen, die für ein oder mehrere Toxine kodieren, sind die transgenen Pflanzen, die unter den folgenden Handelsbezeichnungen angeboten werden: YIELD GARD® (zum Beispiel Mais, Baumwolle, Sojabohnen), KnockOut® (zum Beispiel Mais), BiteGard® (zum Beispiel Mais), BT-Xtra® (zum Beispiel Mais), StarLink® (zum Beispiel Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle), Nucotn 33B® (Baumwolle), NatureGard® (zum Beispiel Mais), Protecta® und NewLeaf® (Kartoffel). Herbizidtolerante Pflanzen, die zu erwähnen sind, sind zum Beispiel Maissorten, Baumwollsorten und Sojabohnensorten, die unter den folgenden Handelsbezeichnungen angeboten werden: Roundup Ready® (Glyphosatetoleranz, zum Beispiel Mais, Baumwolle, Sojabohne), Liberty Link® (Phosphinothricintoleranz, zum Beispiel Raps), IMI® (Imidazolinontoleranz) und SCS® (Sulfonylharnstofftoleranz), zum Beispiel Mais.

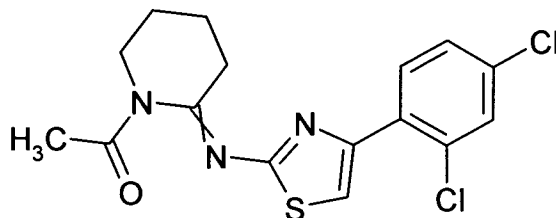
25 Zu den herbizidresistenten Pflanzen (traditionell auf Herbizidtoleranz gezüchtete Pflanzen), die zu erwähnen sind, zählen die unter der Bezeichnung Clearfield® angebotenen Sorten (zum Beispiel Mais).

Besonders nützliche transgene Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen, die Transformations-Events, oder eine Kombination von Transformations-Events, enthalten und die zum Beispiel in den Dateien von verschiedenen nationalen oder regionalen Behörden angeführt sind (siehe zum Beispiel http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx und <http://www.agbios.com/dbase.php>).

30

Herstellungsbeispiele**Synthesebeispiel 52:**

0,34 g (3,26 mmol) Valerolactam werden in 15 ml absoluten 1,2-Dichlorethan vorgelegt und bei
5 Raumtemperatur 0,30 g (1,96 mmol) Phosphoroxichlorid zugetropft. Dann werden innerhalb von 2
Stunden bei Raumtemperatur 0,40 g (1,63 mmol) 4-(3,4-Dichlorphenyl)-1,3-thiazol-2-amin
zugegeben und die Mischung 16 Stunden unter Rückfluß zum Sieden erhitzt. Nach dem Abkühlen
wird bei Raumtemperatur solange 1N-Natriumhydroxidlösung hinzugegeben, bis ein pH-Wert von
14 erreicht ist. Die sirupöse Mischung wird mit Essigester versetzt und solange gerührt, bis sie
10 wieder dünnflüssig ist. Nach Extraktion mit Essigester, Trocknen, Einengen und Reinigung über
Kieselgel (Cyclohexan/Essigester) erhält man 0,21 g (0,64 mmol, 39% der Theorie) 4-(3,4-
Dichlorphenyl)-N-[2-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin als hellgelben Feststoff.

**Synthesebeispiel 35:**

15 0,163 g (0,50 mmol) 4-(2,4-Dichlorphenyl)-N-[2-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin werden in
10 ml Dichlormethan vorgelegt und mit 0,152 g (1,50 mmol) Triethylamin versetzt. Dann werden
bei 0°C 0,133 g (1,30 mmol) Essigsäureanhydrid zugetropft und der Ansatz 18 Stunden bei
Raumtemperatur nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird der Ansatz mit Dichlormethan verdünnt, mit
10%iger Citronensäurelösung gequenchet, mit 1N-Natronlauge gewaschen, getrocknet und
20 eingeeengt. Man erhält 0,230 g (85 % d. Theorie) 1-[2-{[4-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-thiazol-2-
yl]imino}piperidin-1-yl]ethanon als Öl.

Tabelle I:

Bsp.	n	R ¹	R ²	R ³	Log p
1	2	H	H	2-(2,4-Dimethylphenoxy)phenyl	2,66**; 4,9***
2	2	H	H	4-Chlorphenyl	1,7**
3	2	H	H	4-Bromphenyl	1,67**
4	2	H	H	2,4-Dichlorphenyl	1,8**
5	2	H	H	4-Phenoxyphenyl	2,17**; 3,97***
6	2	H	H	3,5-Bis(trifluormethyl)phenyl	2,23**; 4,36***
7	2	H	H	2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl	2,11**; 3,9***; 2,11*
8	2	H	H	2-Chlor-3-(trifluormethyl)phenyl	1,94**; 3,72***
9	2	H	H	4-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl	3,95***; 2,12*
10	2	H	H	2-Phenoxyphenyl	2,09**; 3,91***; 2,07*
11	2	H	H	2-(2,4-Dichlorphenoxy)phenyl	2,42**; 4,84***; 2,42*
12	2	H	H	2-(3-tert-Butyl-4-chlorphenoxy)phenyl	2,92**; 5,96***; 2,92*
13	2	H	H	2-(3-tert-Butylphenoxy)phenyl	
14	2	H	H	2-[4-Chlor-3-(trifluormethyl)phenoxy]phenyl	2,58**; 4,9***; 2,58*
15	2	H	H	2-(Trifluormethoxy)phenyl	1,77**; 3,54***; 1,77*
16	2	Acetyl	H	2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl	4,36**; 4,32***; 4,36*
17	2	Acetyl	H	2-Phenoxyphenyl	4,41**; 4,39***; 4,41*
18	2	H	H	3,4-Difluorphenyl	1,64**; 3,12***; 1,64*
19	2	H	H	2,5-Difluorphenyl	1,58**; 3,16***; 1,58*
20	2	H	H	2-Chlorphenyl	1,63**; 3,19***; 1,63*
21	2	H	H	2-(Trifluormethyl)phenyl	1,76**; 3,25***; 1,76*
22	2	H	H	2-(Prop-2-en-1-yloxy)phenyl	1,83**; 3,45***; 1,83*
23	2	H	H	2-Ethoxyphenyl	1,77**; 3,35***; 1,77*
24	2	H	H	2,3-Dichlorphenyl	1,81**; 3,72***; 1,81*
25	2	H	H	2,3-Difluorphenyl	1,58**; 3,21***; 1,58*
26	2	H	H	2-Fluor-3-(trifluormethyl)phenyl	1,84**; 3,78***; 1,84*
27	2	H	H	3,4-Dimethoxyphenyl	1,35**; 2,36***; 1,35*
28	2	H	H	1,3-Benzodioxol-5-yl	1,41**; 2,65***; 1,41*
29	2	H	H	3,5-Difluorphenyl	1,57**; 3,22***; 1,57*
30	2	H	H	3-Chlor-4-fluorphenyl	1,76**; 3,45***; 1,76*
31	2	H	CH ₃	4-Chlorphenyl	1,84**; 3,72***; 1,84*
32	2	H	H	4-tert-Butylphenyl	2,2**; 4,35***; 2,2*
33	2	Acetyl	H	2-Ethoxyphenyl	2,71**; 5,03***; 2,71*

Bsp.	n	R ¹	R ²	R ³	Log p
34	2	Acetyl	H	4-Chlorphenyl	3,78**; 3,78***; 3,78*
35	2	Acetyl	H	2,4-Dichlorphenyl	4,33**; 4,33***; 4,33*
36	2	Acetyl	H	2,3-Dichlorphenyl	4,03**; 4,02***; 4,03*
37	2	Acetyl	H	2,3-Difluorphenyl	3,63**; 3,63***; 3,63*
38	2	Acetyl	H	2-Fluor-3-(trifluormethyl)phenyl	4,25**; 4,23***; 4,25*
39	2	Acetyl	H	1,3-Benzodioxol-5-yl	2,96**; 2,95***; 2,96*
40	2	Acetyl	H	3,5-Difluorphenyl	3,63**; 3,62***; 3,63*
41	2	Acetyl	H	3-Chlor-4-fluorphenyl	3,88**; 3,88***; 3,88*
42	2	Acetyl	CH ₃	4-Chlorphenyl	3,92**; 3,96***; 3,92*
43	2	Acetyl	CH ₃	2,3-Difluorphenyl	3,37**; 3,37***; 3,37*
44	2	H	CH ₃	2,3-Difluorphenyl	1,7**; 3,2***; 1,7*
45	2	H	H	3-(Trifluormethyl)phenyl	1,97**; 3,55***
46	2	H	H	3-Bromphenyl	1,8**
47	2	H	H	3-(2,2-Dimethylpropyl)phenyl	2,51**; 4,86***
48	2	H	H	2-Bromphenyl	1,58**; 3,25***
49	2	H	H	4-(Difluormethoxy)phenyl	1,44**
50	2	H	H	4-(Trifluormethoxy)phenyl	1,78**
51	2	H	H	2,6-Dichlorphenyl	1,42**
52	2	H	H	3,4-Dichlorphenyl	3,93***; 1,68*
53	2	H	H	2-Chlorpyridin-3-yl	0,71*
54	2	H	H	4-Fluorphenyl	1,23*
55	2	H	H	3,5-Dichlorphenyl	4,21***; 1,59*
56	2	H	H	4-Methoxyphenyl	1,18*
57	2	H	H	3-Methoxyphenyl	2,76***; 1,19*
58	2	H	H	2,6-Dimethylpyridin-3-yl	
59	2	H	H	3-Chlorphenyl	1,37**
60	2	H	H	3-Methylphenyl	1,32*
61	2	H	H	Pyridin-2-yl	0,27**
62	2	H	H	6-Methylpyridin-2-yl	2,13***; 0,29*
63	2	H	H	6-Chlorpyridin-3-yl	2,38***; 0,94*
64	2	H	H	Biphenyl-2-yl	1,82**
65	2	H	H	3'-Methylbiphenyl-2-yl	2**
66	2	H	H	3',4'-Dichlorbiphenyl-2-yl	2,2**
67	2	H	H	4'-Methoxybiphenyl-2-yl	1,83**
68	2	H	H	4'-Methoxybiphenyl-3-yl	3,88***; 1,85*

Bsp.	n	R ¹	R ²	R ³	Log p
69	2	H	H	2-Chlorbenzyl	1,39*
70	2	H	H	3-Chlorbenzyl	3,36***; 1,58*
71	2	H	H	3'-Methylbiphenyl-3-yl	4,48***; 2,12*
72	2	H	H	Cyclopropylmethyl	2,73***; 1,07*
73	2	H	H	1-Phenylethyl	3,27***; 1,51*
74	2	H	H	2-(4-Chlorphenoxy)phenyl	2,03*
75	2	H	H	2-(4-Fluorphenoxy)phenyl	1,87*
76	2	H	H	2-(2,6-Difluorphenoxy)phenyl	3,78***; 1,8*
77	2	H	H	2-(2,3,4-Trifluorphenoxy)phenyl	4,17***; 2,01*
78	2	H	H	2-(3,4-Difluorphenoxy)phenyl	4,18***; 1,83*
79	2	H	H	2-(4-Methylphenoxy)phenyl	4,51***; 2,17*
80	2	H	H	2-(2,5-Difluorphenoxy)phenyl	3,98***; 1,94*
81	2	H	H	2-Benzylphenyl	2,02***
82	2	H	H	2-(2,4,6-Trifluorphenoxy)phenyl	3,96***; 2,02*
83	2	H	H	2-(3-Fluorphenoxy)phenyl	1,95*
84	2	H	H	2-(4-Bromphenoxy)phenyl	2,14*
85	2	H	H	2-(3-Chlorphenoxy)phenyl	2,16*
86	2	H	H	2-(2-Bromphenoxy)phenyl	4,38***; 2,06*
87	2	H	H	2-(3-Bromphenoxy)phenyl	4,71***; 2,19*
88	2	H	H	2-(2,4-Difluorbenzyl)phenyl	4,27***; 2,04*
89	2	H	H	2-(3,5-Dichlorbenzyl)phenyl	2,43**; 5,35***
90	2	H	H	2-(4-Fluorbenzyl)phenyl	1,95**; 4,19***
91	2	H	H	2-(2,6-Dichlorbenzyl)phenyl	2,16**; 4,36***
92	2	H	H	2-(3,4-Dichlorbenzyl)phenyl	5,07***; 2,36*
93	2	H	H	2-(4-Chlorbenzyl)phenyl	2,17**; 4,7***
94	2	H	H	4-Benzylphenyl	2,07**; 4,28***
95	1	H	H	2-(2,4-Dimethylphenoxy)phenyl	2,52**; 2,48***
96	1	H	H	4-Chlorphenyl	1,57**
97	1	H	H	4-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl	3,59***; 2,03*
98	1	H	H	2-Phenoxyphenyl	2,05**; 3,54***; 1,92*
99	1	H	H	2-(2,4-Dichlorphenoxy)phenyl	2,49**; 4,43***; 2,49*
100	1	H	H	2-(3-tert-Butylphenoxy)phenyl	
101	1	H	H	2-(3-tert-Butyl-4-chlorphenoxy)phenyl	3,09**; 5,53***; 3,09*
102	1	H	H	2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl	3,55***; 1,98*
103	2	H	H	4-Chlorphenyl	1,68**; 3,47***; 1,68*

Bsp.	n	R ¹	R ²	R ³	Log p
104	2	H	H	2,4-Dichlorphenyl	1,76**; 3,92***; 1,76*
105	2	H	H	3-(Trifluormethyl)phenyl	1,75**
106	2	H	H	3-Bromphenyl	1,53**
107	2	H	H	2-Bromphenyl	1,38**

Die Messung der logP Werte erfolgte gemäß EEC Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an reversed-phase Säulen (C 18), mit der nachfolgenden Methode:

- 5 ^[*] Die Bestimmung erfolgt im sauren Bereich bei pH 2.3 mit 0,1% wässriger Phosphorsäure und Acetonitril als Eluenten

linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 95% Acetonitril.

^[**] Die Bestimmung mit der LC-MS im sauren Bereich erfolgt bei pH 2,7 mit 0,1 % wässriger Ameisensäure und Acetonitril (enthält 0,1% Ameisensäure) als Eluenten

- 10 linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 95% Acetonitril

^[***] Die Bestimmung mit der LC-MS im neutralen Bereich erfolgt bei pH 7.8 mit 0,001 molarer wässriger Ammoniumhydrogencarbonat-Lösung und Acetonitril als Eluenten

linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 95 % Acetonitril.

- 15 Die Eichung erfolgt mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinander folgenden Alkanonen).

Biologische Beispiele**Beispiel 1****Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv**

Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N, N - Dimethylformamid

5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

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

10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Sphaerotheca fuliginea* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

15 7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

20 In diesem Test zeigen die erfindungsgemäßen Amino-thiazole der Formeln 1, 2, 6, 7, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 17, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 26, 29, 30, 36, 37, 38, 40, 45, 46, 48, 52, 53, 55, 59, 60, 61, 67, 68, 69, 71, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 95, 98, 99, 102, 103, 104, 105, 106, 107 gemäß Tabelle I bei einer Konzentration an Wirkstoff von 500ppm einen Wirkungsgrad von 70% oder mehr.

Beispiel 2**Alternaria-Test (Tomate) / protektiv**

Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

5 Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

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.

10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Alternaria solani* inokuliert. Die Pflanzen werden dann in einer Inkubationskabine bei ca. 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

15 3 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

In diesem Test zeigen die erfindungsgemäßen Aminothiazole der Formeln 7, 8, 17, 75, 81, 83, 86, 87, 88, 90, 93, 98 gemäß Tabelle I bei einer Konzentration an Wirkstoff von 100ppm einen Wirkungsgrad von 70% oder mehr.

Beispiel 3**Uromyces - Test (Bohne) / protektiv**

Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

5 Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

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.

10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension des Bohnenrosterregers *Uromyces appendiculatus* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubations-kabine.

15 Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90% aufgestellt.

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

20 In diesem Test zeigen die erfindungsgemäßen Aminothiazole der Formeln **16, 17, 26, 75, 81, 83, 86, 90** gemäß Tabelle I bei einer Konzentration an Wirkstoff von 10ppm einen Wirkungsgrad von 70% oder mehr.

Beispiel 4**Puccinia triticina -Test (Weizen) / protektiv**

Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

- 5 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.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit besprüht man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge.

- 10 Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit Sporen einer Sporensuspension von *Puccinia triticina* besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80 % aufgestellt.

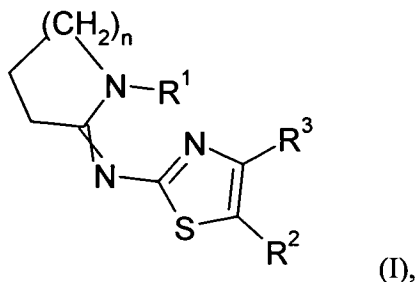
- 15 8 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

In diesem Test zeigen die erfindungsgemäßen Aminothiazole **7, 8, 9, 10, 11, 14, 16, 17, 22, 24, 26, 27, 68, 81, 82, 83, 84, 85, 87, 88, 90, 93, 98, 99, 102** gemäß Tabelle I bei einer Konzentration an

- 20 Wirkstoff von 500 ppm einen Wirkungsgrad von 70% oder mehr.

Patentansprüche:

1. Verbindungen der Formel (I)



in welcher

- 5 R^1 ausgewählt ist aus Wasserstoff; linearen, verzweigten C_{1-12} -Alkyl-, C_{2-12} -Alkenyl-, C_{2-12} -Alkynyl-, cyclischen C_{3-8} -Alkyl-, C_{4-8} -Alkenyl-, C_{4-8} -Alkynyl- oder C_{5-18} -Aryl-, C_{7-19} -Aralkyl- oder C_{7-19} -Alkaryl-Gruppen, -COOR', -COR', -CONR₂', wobei im Ringsystem aller zuvor genannten cyclischen Gruppen ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor
- 10 genannten Gruppen mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN und -CONR₂' substituiert sein können, wobei R' Wasserstoff oder eine lineare oder verzweigte C_{1-12} -Alkyl-, C_{1-6} -Haloalkyl- oder cyclische C_{3-8} -Alkyl-Gruppe ist, die 1 bis 6 Halogenatome aufweisen kann;
- 15 R^2 ausgewählt ist aus Wasserstoff und linearen oder verzweigten C_{1-6} -Alkyl-, C_{2-12} -Alkenyl-, C_{2-12} -Alkynyl-, cyclischen C_{3-8} -Alkyl-, C_{4-8} -Alkenyl-, C_{4-8} -Alkynyl- oder C_{5-18} -Aryl-, C_{7-19} -Aralkyl- oder C_{7-19} -Alkaryl-Gruppen, wobei im Ringsystem aller zuvor genannten cyclischen Gruppen ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor genannten Gruppen
- 20 mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN und -CONR₂', substituiert sein können, wobei R' die obigen Bedeutungen hat;
- 25 R^3 ausgewählt ist aus linearen oder verzweigten C_{1-6} -Alkyl-, C_{2-12} -Alkenyl-, C_{2-12} -Alkynyl-, cyclischen C_{3-8} -Alkyl-, C_{4-8} -Alkenyl-, C_{4-8} -Alkynyl- oder C_{5-18} -Aryl-, C_{7-19} -Aralkyl- oder C_{7-19} -Alkaryl-Gruppen, wobei im Ringsystem aller zuvor genannten cyclischen Gruppen ein oder mehrere C-Atome durch Heteroatome, ausgewählt aus N, O, P und S, ersetzt sein können und alle zuvor genannten Gruppen mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus -

5 R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN, C₅₋₁₈-Aryl-, C₅₋₁₈-Aryloxy-, C₂₋₁₂-Alkenyloxy-, C₇₋₁₉-Aralkyl- und -CONR'₂', substituiert sein können, wobei R' die obigen Bedeutungen hat und die C₅₋₁₈-Aryl-, C₅₋₁₈-Aryloxy-, C₂₋₁₂-Alkenyloxy- und C₇₋₁₉-Aralkyl-Gruppen mit einem, zwei oder mehreren Resten substituiert sein können, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus - R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN, Aryloxy- und -CONR'₂', worin R' die obigen Bedeutungen hat;

n 0, 1 oder 2 ist,

oder deren Salze, N-Oxide, Metallkomplexe und Stereoisomere.

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

R¹ ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, C₁₋₈-Alkyl-Gruppen, -COOR', -COR', -CONR'₂', wobei R' die obigen Bedeutungen hat;

R² ausgewählt ist aus Wasserstoff und linearen oder verzweigten C₁₋₈-Alkyl-Gruppen;

15 R³ ausgewählt ist aus Phenyl- oder Phenyl-C₁₋₄-Alkyl-Gruppen, die am Phenylring mit einem, zwei oder mehreren Halogenatomen, Phenyl-, Phenoxy-, C₂₋₆-Alkenyloxy-, C₁₋₆-Alkoxy-, Phenyl-C₁₋₄-Alkyl-Gruppen oder C₁₋₅-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können oder an die fünf, sechs oder siebengliedrige carbocyclische oder heterocyclische Ringe anneliert sein können und die im Ring ein oder zwei Heteroatome aufweisen können, die ausgewählt sind aus O und N, wobei alle
20 genannten Gruppen mit Halogenatomen, C₁₋₆-Alkyl-, C₁₋₆-Alkoxy- oder C₁₋₅-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;

n 0 oder 1 ist

oder deren Salze, N-Oxide, Metallkomplexe und Stereoisomere.

3. Verbindungen der Formel (I), gemäß einem der Ansprüche 1 oder 2, in welcher

25 R¹ ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, C₁₋₈-Alkyl-Gruppen, -COOR', -COR', -CONR'₂'

R² Wasserstoff ist;

R³ ausgewählt ist aus

- 5 - Phenyl-, Benzyl- oder Phenethyl-Gruppen, die mit einem, zwei oder mehreren Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen oder mit Phenyl- oder Benzyl-Gruppen substituiert sein können, wobei letztere Phenyl- oder Benzyl-Gruppen mit einem, zwei oder mehreren Halogenatomen, Methyl- oder Methoxy-Gruppen substituiert sein können;
- Phenoxyphenyl- oder Diphenoxyphenyl-Gruppen, die im Phenoxy-Rest mit einem oder zwei Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;
- 10 - C₂₋₆-Alkenyloxyphenyl-Gruppen, die mit einem oder zwei Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;
- C₁₋₆-Alkoxyphenyl-Gruppen, die mit einem oder zwei Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;
- 15 - 1,3-Benzodioxol-5-yl-Gruppen;
- Pyridyl-Gruppen, die mit einem oder zwei Halogenatomen, linearen oder verzweigten C₁₋₆-Alkyl- oder C₁₋₆-Haloalkyl-Gruppen substituiert sein können;
- 20 - C₃₋₆-Cycloalkyl-C₁₋₄-Alkyl-Gruppen

n 1 ist

oder deren Salze, N-Oxide, Metallkomplexe und deren Stereoisomere.

4. Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3 ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus 4-[2-(2,4-Dimethylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Bromphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,4-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Phenoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[3,5-Bis(trifluormethyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-Chlor-3-(trifluormethyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[4-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-

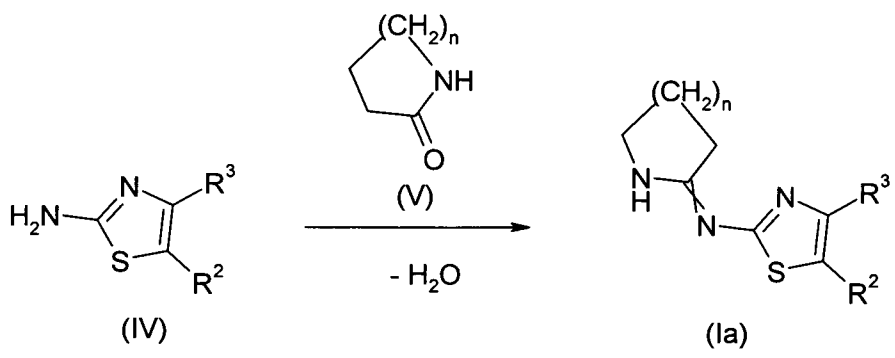
[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Phenoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Dichlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-tert-Butyl-4-chlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-tert-Butylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-{2-[4-Chlor-3-(trifluormethyl)phenoxy]phenyl}-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(trifluormethoxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 1-[(2E/Z)-2-({4-[2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2-Phenoxyphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 4-(3,4-Difluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,5-Difluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(trifluormethyl)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(prop-2-en-1-yloxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Ethoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,3-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,3-Difluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-Fluor-3-(trifluormethyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3,4-Dimethoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(1,3-Benzodioxol-5-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3,5-Difluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Chlor-4-fluorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Chlorphenyl)-5-methyl-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-tert-Butylphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2-Ethoxyphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(4-Chlorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2,3-Dichlorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2,3-Difluorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-[2-Fluor-3-(trifluormethyl)phenyl]-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(1,3-Benzodioxol-5-yl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(3,5-Difluorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(3-Chlor-4-fluorphenyl)-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(4-Chlorphenyl)-5-methyl-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 1-[(2E/Z)-2-({4-(2,3-Difluorphenyl)-5-methyl-1,3-thiazol-2-yl}imino)piperidin-1-yl]ethanon, 4-(2,3-Difluorphenyl)-5-methyl-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[3-(trifluormethyl)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Bromphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[3-(2,2-Dimethylpropyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Bromphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-

yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[4-(Difluormethoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-
1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[4-(trifluormethoxy)phenyl]-1,3-
thiazol-2-amin, 4-(2,6-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-
(3,4-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Chlorpyridin-
3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Fluorphenyl)-N-[(2E/Z)-
piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3,5-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-
yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Methoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-
thiazol-2-amin, 4-(3-Methoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-
(2,6-Dimethylpyridin-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-
Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Methylphenyl)-N-
[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-(pyridin-
2-yl)-1,3-thiazol-2-amin, 4-(6-Methylpyridin-2-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-
thiazol-2-amin, 4-(6-Chlorpyridin-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin,
4-(Biphenyl-2-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3'-Methylbiphenyl-
2-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3',4'-Dichlorbiphenyl-2-yl)-N-
[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4'-Methoxybiphenyl-2-yl)-N-[(2E/Z)-
piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4'-Methoxybiphenyl-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-
2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Chlorbenzyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-
2-amin, 4-(3-Chlorbenzyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3'-
Methylbiphenyl-3-yl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-
(Cyclopropylmethyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(1-Phenylethyl)-
N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Chlorphenoxy)phenyl]-N-
[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Fluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-
piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,6-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-
piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(2,3,4-
trifluorphenoxy)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-
piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Methylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-
piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,5-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-
piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Benzylphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-
1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[2-(2,4,6-trifluorphenoxy)phenyl]-1,3-
thiazol-2-amin, 4-[2-(3-Fluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-
amin, 4-[2-(4-Bromphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-
[2-(3-Chlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2-
Bromphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-
Bromphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-
Difluorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3,5-
Dichlorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-

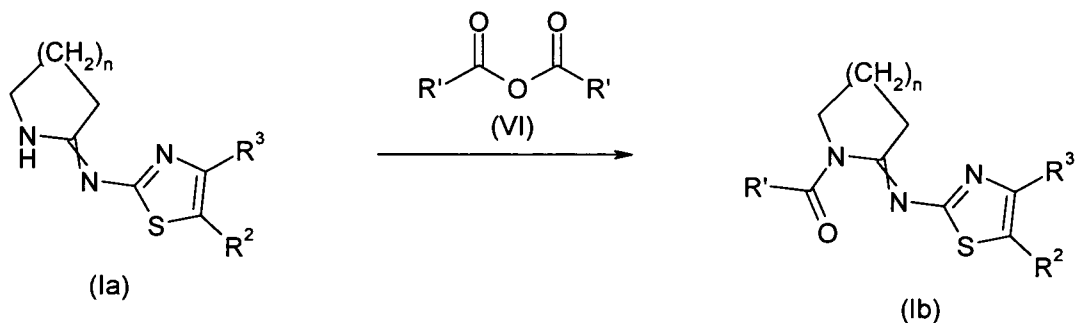
Fluorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,6-Dichlorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3,4-Dichlorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(4-Chlorbenzyl)phenyl]-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Benzylphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Dimethylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[4-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Phenoxyphenyl)-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Dichlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-tert-Butylphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(3-tert-Butyl-4-chlorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-[2-(2,4-Difluorphenoxy)phenyl]-N-[(2E/Z)-pyrrolidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(4-Chlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2,4-Dichlorphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, N-[(2E/Z)-Piperidin-2-yliden]-4-[3-(trifluormethyl)phenyl]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(3-Bromphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin, 4-(2-Bromphenyl)-N-[(2E/Z)-piperidin-2-yliden]-1,3-thiazol-2-amin.

5. Verfahren zum Herstellen der Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 umfassend wenigstens einen der folgenden Schritte (c) oder (d):

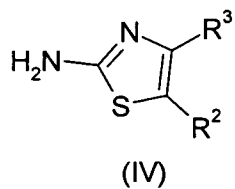
(c) Umsetzung eines 2-Aminothiazols der Formel (IV) mit einem Lactam der Formel (V), wobei n die zuvor beschriebenen Bedeutungen hat, in Anwesenheit von einem Kondensationsmittel, zu einer Verbindung der Formel (Ia)



(d) Umsetzung einer Verbindung der Formel (Ia) mit einem Carbonsäureanhydrid der Formel (VI) zu einer Verbindung der Formel (Ib).

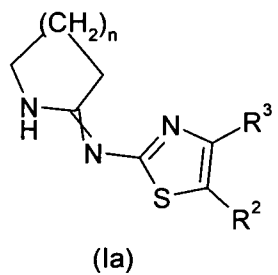


6. Verbindung der Formel (IV)



worin die Reste R² und R³ die in den Ansprüchen 1 bis 3 beschriebenen Bedeutungen haben.

5 7. Verbindung der Formel (Ia)



worin die Reste R² und R³ und n die in den Ansprüchen 1 bis 3 beschriebenen Bedeutungen haben.

8. Mittel zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, umfassend wenigstens eine
10 Verbindung der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4.
9. Verwendung einer Verbindung der Formel (I) gemäß irgendeinem der Ansprüche 1 bis 4
oder Mischungen dieser zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen.
10. Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet,
15 dass Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 auf die
Mikroorganismen und/oder in deren Lebensraum ausgebracht werden.
11. Saatgut, welches mit wenigstens einer Verbindung der Formel (I) gemäß einem der
Ansprüche 1 bis 4 behandelt ist.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2010/004103

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D417/12 C07D277/42 A01N43/78
ADD.

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A01N

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

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

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	LIEBSCHER J ET AL: "RING TRANSFORMATIONS VIA BRIDGED 1,3-DICARBONYL HETEROANALOGS; PART II. SYNTHESIS OF 4-(OMEGA-AMINOALKYL)-THIAZOLES BY A NOVEL RING TRANSFORMATION REACTION OF SEMICYCLIC THIOACYLAMIDINES WITH ACIDIC METHYL HALIDES" SYNTHESIS, GEORG THIEME VERLAG, STUTTGART, DE, vol. 12, 1 January 1989 (1989-01-01), pages 968-970, XP001026249 ISSN: 0039-7881 page 970; compounds 6a-6c	1-4
X	Aldrich: "Catalogue Handbook of Fine Chemicals" 1990, Aldrich, Brussel, XP002563995 page 87 - page 87; compounds 24969-6	6
	----- -/--	



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

16 August 2010

Date of mailing of the international search report

23/08/2010

Name and mailing address of the ISA/

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

Authorized officer

Megido, Benigno

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2010/004103

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	SWAIN G: "Thiazole analogs of desthiobiotin" CA, JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, LONDON, ENGLAND, 1 January 1949 (1949-01-01), pages 2898-2901, XP002995754 ISSN: 0368-1769 page 2899; compound VII -----	6
X	PRITHWI NATH BHARGAVA ET AL: "SYNTHESIS OF NEW LOCAL ANAESTHETICS. PART II" JOURNAL OF THE INDIAN CHEMICAL SOCIETY, THE INDIAN CHEMICAL SOCIETY, CALCUTTA; IN, vol. 37, no. 4, 1 January 1960 (1960-01-01), pages 241-243, XP008031880 ISSN: 0019-4522 page 241; compound 6 -----	6
X	SOUTHWICK; SAPPER: "4-Styrylthiazoles. Syntheses and relationships among ultraviolet absorption spectra" JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, vol. 19, 1954, pages 1926-1937, XP002563996 ISSN: 0022-3263 page 1926; compounds IIId, IIe -----	6
X	ERLENMEYER H ET AL: "Ueber einige Derivate des 2-Aminothiazols" HELVETICA CHIMICA ACTA, VERLAG HELVETICA CHIMICA ACTA, BASEL, CH, vol. 32, no. 1, 1 February 1949 (1949-02-01), pages 35-38, XP002202205 ISSN: 0018-019X page 35; compound 4 -----	6
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 2 November 2000 (2000-11-02), XP002563997 retrieved from STN Database accession no. 300851-72-3 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE CHEMCATS Chemical Abstract Service; 6 July 2009 (2009-07-06), XP002564129 retrieved from STN Database accession no. 2086369943 * abstract ----- ----- -/--	1-4,7

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2010/004103

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 19 March 2001 (2001-03-19), XP002564118 retrieved from STN Database accession no. 328039-30-1 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 31 October 2000 (2000-10-31), XP002564122 retrieved from STN Database accession no. 300568-62-1 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 2 January 2002 (2002-01-02), XP002564124 retrieved from STN Database accession no. 380183-46-0 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 21 December 2001 (2001-12-21), XP002564125 retrieved from STN Database accession no. 377760-05-9 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 29 September 2004 (2004-09-29), XP002564128 retrieved from STN Database accession no. 753466-17-0 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 29 September 2004 (2004-09-29), XP002565543 retrieved from STN Database accession no. 753465-01-9 * abstract ----- -/--	1-4,7

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2010/004103

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 8 June 2006 (2006-06-08), XP002564134 retrieved from STN Database accession no. 887203-42-1 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 8 June 2006 (2006-06-08), XP002565544 retrieved from STN Database accession no. 887203-39-6 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 5 June 2006 (2006-06-05), XP002565545 retrieved from STN Database accession no. 887203-36-3 * abstract -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 8 June 2006 (2006-06-08), XP002565546 retrieved from STN Database accession no. 887203-33-0 * abstract -----	1-4,7

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2010/004103

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

INV. C07D417/12 C07D277/42 A01N43/78
ADD.

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

C07D A01N

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

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

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

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	LIEBSCHER J ET AL: "RING TRANSFORMATIONS VIA BRIDGED 1,3-DICARBONYL HETEROANALOGS; PART II. SYNTHESIS OF 4-(OMEGA-AMINOALKYL)-THIAZOLES BY A NOVEL RING TRANSFORMATION REACTION OF SEMICYCLIC THIOACYLAMIDINES WITH ACIDIC METHYL HALIDES" SYNTHESIS, GEORG THIEME VERLAG, STUTTGART, DE, Bd. 12, 1. Januar 1989 (1989-01-01), Seiten 968-970, XP001026249 ISSN: 0039-7881 Seite 970; Verbindungen 6a-6c	1-4
X	Aldrich: "Catalogue Handbook of Fine Chemicals" 1990, Aldrich, Brussel, XP002563995 Seite 87 - Seite 87; Verbindungen 24969-6	6
-/--		

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen ☐ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen:

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

16. August 2010

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

23/08/2010

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

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

Bevollmächtigter Bediensteter

Megido, Benigno

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	SWAIN G: "Thiazole analogs of desthiobiotin" CA, JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, LONDON, ENGLAND, 1. Januar 1949 (1949-01-01), Seiten 2898-2901, XP002995754 ISSN: 0368-1769 Seite 2899; Verbindung VII -----	6
X	PRITHWI NATH BHARGAVA ET AL: "SYNTHESIS OF NEW LOCAL ANAESTHETICS. PART II" JOURNAL OF THE INDIAN CHEMICAL SOCIETY, THE INDIAN CHEMICAL SOCIETY, CALCUTTA; IN, Bd. 37, Nr. 4, 1. Januar 1960 (1960-01-01), Seiten 241-243, XP008031880 ISSN: 0019-4522 Seite 241; Verbindung 6 -----	6
X	SOUTHWICK; SAPPER: "4-Styrylthiazoles. Syntheses and relationships among ultraviolet absorption spectra" JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, Bd. 19, 1954, Seiten 1926-1937, XP002563996 ISSN: 0022-3263 Seite 1926; Verbindungen IIId, IIe -----	6
X	ERLENMEYER H ET AL: "Ueber einige Derivate des 2-Aminothiazols" HELVETICA CHIMICA ACTA, VERLAG HELVETICA CHIMICA ACTA, BASEL, CH, Bd. 32, Nr. 1, 1. Februar 1949 (1949-02-01), Seiten 35-38, XP002202205 ISSN: 0018-019X Seite 35; Verbindung 4 -----	6
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 2. November 2000 (2000-11-02), XP002563997 gefunden im STN Database accession no. 300851-72-3 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE CHEMCATS Chemical Abstract Service; 6. Juli 2009 (2009-07-06), XP002564129 gefunden im STN Database accession no. 2086369943 * Zusammenfassung -----	1-4,7
	-/--	

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 19. März 2001 (2001-03-19), XP002564118 gefunden im STN Database accession no. 328039-30-1 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 31. Oktober 2000 (2000-10-31), XP002564122 gefunden im STN Database accession no. 300568-62-1 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 2. Januar 2002 (2002-01-02), XP002564124 gefunden im STN Database accession no. 380183-46-0 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 21. Dezember 2001 (2001-12-21), XP002564125 gefunden im STN Database accession no. 377760-05-9 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 29. September 2004 (2004-09-29), XP002564128 gefunden im STN Database accession no. 753466-17-0 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 29. September 2004 (2004-09-29), XP002565543 gefunden im STN Database accession no. 753465-01-9 * Zusammenfassung -----	1-4,7
	-/--	

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 8. Juni 2006 (2006-06-08), XP002564134 gefunden im STN Database accession no. 887203-42-1 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 8. Juni 2006 (2006-06-08), XP002565544 gefunden im STN Database accession no. 887203-39-6 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 5. Juni 2006 (2006-06-05), XP002565545 gefunden im STN Database accession no. 887203-36-3 * Zusammenfassung -----	1-4,7
X	DATABASE REGISTRY CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 8. Juni 2006 (2006-06-08), XP002565546 gefunden im STN Database accession no. 887203-33-0 * Zusammenfassung -----	1-4,7