

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2004-509865

(P2004-509865A)

(43) 公表日 平成16年4月2日(2004.4.2)

(51) Int.Cl. ⁷	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 207/277	C O 7 D 207/277	4 C O 6 3
A O 1 N 43/36	A O 1 N 43/36	4 C O 6 9
A 6 1 K 31/40	A 6 1 K 31/40	4 C O 8 6
A 6 1 K 31/4025	A 6 1 K 31/4025	4 H O 1 1
A 6 1 K 31/427	A 6 1 K 31/427	4 H O 3 9
審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 238 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2002-529059 (P2002-529059)	(71) 出願人	302063961
(86) (22) 出願日	平成13年9月10日 (2001.9.10)		バイエル・クロツプサイエンス・アクチエ ンゲゼルシャフト
(85) 翻訳文提出日	平成15年3月20日 (2003.3.20)		ドイツ40789モンハイム・アルフレー ト・ノペル・シュトラッセ50
(86) 国際出願番号	PCT/EP2001/010422		
(87) 国際公開番号	W02002/024646	(74) 代理人	100060782
(87) 国際公開日	平成14年3月28日 (2002.3.28)		弁理士 小田島 平吉
(31) 優先権主張番号	100 47 116.1	(72) 発明者	ヤンゼン, ヨハネス・スールドルフ
(32) 優先日	平成12年9月22日 (2000.9.22)		ドイツ40789モンハイム・クニツブラ ターシュトラッセ47
(33) 優先権主張国	ドイツ (DE)	(72) 発明者	プラント, アンドリユー
			イギリス・パークシャー アールジー41 /5 ピーデー・ウイナーシュ・メドウビュ ー1
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としてのデルタ1-ピロリン類

(57) 【要約】

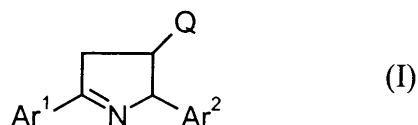
本発明は式 (I) の新規 Δ^1 -ピロリン類 (式中、 $A r^1$ 、 $A r^2$ および Q は明細書に記載した意味を有する)、これらの物質の幾つかの製造法、および有害生物を防除するためのそれらの使用に関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

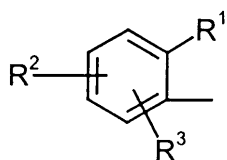
【化 1】



式中、

Ar¹ は基

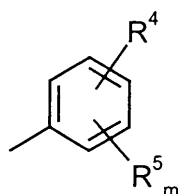
【化 2】



を表し、そして

Ar² は基

【化 3】



を表し、

ここで

m は 0、1、2、3 または 4 を表し、

R¹ はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、アルコキシアルキル、 $-S(O)_0 R^6$ または $-NR^7 R^8$ を表し、

R² および R³ は互いに独立して各々が水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、アルコキシアルキル、 $-S(O)_0$

R⁶ または $-NR^7 R^8$ を表し、

R⁴ はハロゲンまたは以下の基の 1 つ

(l) $-X-A$

(m) $-B-Z-D$

(n) $-Y-E$

を表し、

R⁵ はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $-CONH_2$ 、 $-CSNH_2$ 、ニトロ、アルキル、アルキルカルボニル、アルキコシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルスルホニルオキシ、トリアルキルシリル、アルコキシカルボニル、 $-CONR^7 R^8$ 、 $-OSO_2 NR^7 R^8$ 、 $-S(O)_0 R^6$ 、 $-NR^7 R^8$ 、 $-NHCO_2 R^6$ 、ハロゲノアルキルアミノスルホニル、ビスアルコキシボランまたは $-B(OH)_2$ を表し、

X は直接結合、酸素、 $-S(O)_0$ 、 $-NR^6$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、オキシスルホニル (OSO_2)、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アルキレンオキシ、オキシアルキレン、オキシアルキレンオキシ、チオアルキレン、シ

10

20

30

40

50

クロプロピレンまたはオキシラニレンを表し、

Aは各々が場合により W^1 のリストからの基でモノーもしくはポリー置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはテトラヒドロナフチルを表すか、あるいは窒素、酸素および硫黄よりなる群からの1個以上のヘテロ原子を含み且つ場合により W^2 のリストからの基でモノーもしくはポリー置換されていてもよい5-ないし10-員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを表し、

Bは場合により W^1 のリストからの基でモノーもしくはジ-置換されていてもよいp-フェニレンを表し、

Zは $-(CH_2)_n-$ 、酸素または $-S(O)_o-$ を表し、

Dは水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルケニル、ハロゲノアルキルスルホニルまたはジアルキルアミノスルホニルを表し、 10

Yは直接結合、酸素、硫黄、 $-SO_2-$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アルキレンオキシ、オキシアルキレン、オキシアルキレンオキシ、チオアルキレン、ハロゲノアルキレンまたはハロゲノアルケニレンを表し、

Eは水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルケニル、ハロゲノアルキルスルホニルまたはジアルキルアミノスルホニルを表し、

W^1 はシアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、アルキル、トリアルキルシリル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、ハロゲノアルキルスルホニルオキシ、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ペンタフルオロチオ、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$ 、 $-OSO_2R^{12}$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、 20

W^2 はシアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、アルキル、トリアルキルシリル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、ハロゲノアルキルスルホニルオキシ、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、

nは0、1、2、3または4を表し、

Qは $-CO_2R^9$ 、 $-COR^{10}$ 、 $-CONR^7R^8$ 、 $-CN$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CSNH_2$ 、 $-S(O)_oR^6$ 、 30

$-SO_2NR^7R^8$ 、 $-PO(OR^{11})_2$ 、窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2~4個のヘテロ原子を含む5~7員の飽和もしくは不飽和複素環を表し、

Qはさらに $-CO_2R^{13}$ または $-CONR^{14}R^{15}$ を表し、

oは0、1または2を表し、

R^6 は水素、アルキルまたはハロゲノアルキルを表し、

R^7 および R^8 は互いに独立して各々が水素、アルキル、シクロアルキル、ハロゲノアルキルを表すか、または一緒になってアルキレンを表し、

R^9 は水素、アルキル、シクロアルキル、ハロゲノアルキル、アラルキルまたはフェニルを表し、

R^{10} はアルキル、ハロゲノアルキルまたはアラルキルを表し、 40

R^{11} はアルキルまたはアリールを表し、

R^{12} はアルキル、ハロゲノアルキル、アラルキルまたはアリールを表し、

R^{13} は水素を表し；モノーもしくはポリー置換されたアルキルを表し；場合により置換されていてもよいアミノカルボニルアルキルを表し；アルケニルまたはフェニルアルケニルを表し；各々の場合に場合により置換されていてもよいフェニルアルキルまたはフェノキシアルキルを表し；各々の場合に場合により置換されていてもよいシクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルを表し；各々が窒素、酸素および硫黄よりなる群から選択される1~4個のヘテロ原子を含む飽和もしくは不飽和のヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルを表し；あるいはテトラヒドロナフチルまたはインダニルを表し、

R^{14} および R^{15} は互いに独立して各々が水素、ハロゲノアルキルまたはアルコキシア 50

ルキルを表し；各々の場合に場合により置換されていてもよいフェニルまたはフェニルアルキルを表し；各々の場合に場合により置換されていてもよいシクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルを表し；あるいは各々の場合に場合により置換されていてもよく、各々の場合に飽和もしくは不飽和の、各々が窒素、酸素および硫黄よりなる群からの1～4個のヘテロ原子を含むヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルを表し、

R^{1-4} および R^{1-5} はさらに一緒になってアルキレンオキシアルキレンまたはアルキレンチオアルキレンを表す、

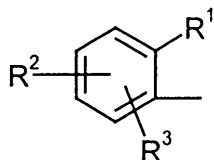
の Δ^1 -ピロリン類。

【請求項2】

Ar^1 が基

10

【化4】

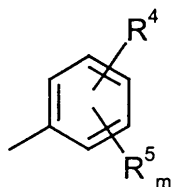


を表し、そして

Ar^2 が基

【化5】

20



を表し、

ここで、

m が 0、1、2 または 3 を表し、

R^1 がハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $-S(O)_0 R^6$ または $-NR^7 R^8$ を表し、

R^2 および R^3 が互いに独立して各々が水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、

$C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、

$-S(O)_0 R^6$ または $-NR^7 R^8$ を表し、

R^4 がフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、またはアリール環のオルト-もしくはパラ-位に位置する以下の基の1つ

(1) $-X-A$

(m) $-B-Z-D$

(n) $-Y-E$

40

を表し、

R^5 がハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $-CONH_2$ 、 $-CSNH_2$ 、ニトロ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルキコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルコキシ、($C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキル)スルホニルオキシ、トリ($C_1 - C_6$ -アルキル)-シリル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $-CONR^7 R^8$ 、 $-OSO_2 NR^7 R^8$ 、 $-S(O)_0 R^6$ 、 $-NR^7 R^8$ 、 $-NHCO_2 R^6$ 、($C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキル)アミノスルホニル、ビス($C_1 - C_6$ -アルコキシ)ボランまたは $-B(OH)_2$ を表し、

X が直接結合、酸素、 $-S(O)_0$ 、 $-NR^6$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシ

50

カルボニル、オキシスルホニル (OSO_2)、 C_1-C_4 -アルキレン、 C_2-C_4 -アルケニレン、 C_2-C_4 -アルキニレン、 C_1-C_4 -アルキレンオキシ、 C_1-C_4 -オキシアルキレン、 C_1-C_4 -オキシアルキレンオキシ、 C_1-C_4 -チオアルキレン、シクロプロピレンまたはオキシラニレンを表し、

Aが各々が場合により W^1 のリストからの基でモノーないしテトラ置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはテトラヒドロナフチルを表すか、あるいは1もしくは2個の芳香族環および0~4個の窒素原子、0~2個の酸素原子および0~2個の硫黄原子よりなる群から選択される1~4個のヘテロ原子を含み且つ場合により W^2 のリストからの基でモノーないしテトラ置換されていてもよい5~ないし10員のヘテロシクリル（特にテトラゾリル、フリル、ベンゾフリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピロリル、インドリル、オキサゾリル、ベンズオキサゾリル、イソキサジル、イミダジル、ピラジル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアジル、キノリニルまたはイソキノリニル）を表し、

Bが場合により W^1 のリストからの基でモノーもしくはジ置換されたp-フェニレンを表し、

Zが $-(\text{CH}_2)_n-$ 、酸素または $-S(O)_0-$ を表し、

Dが水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニル、(C_1-C_6 -ハロゲノアルキル)スルホニルまたはジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノスルホニルを表し、

Yが直接結合、酸素、硫黄、 $-\text{SO}_2-$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキレン、 C_2-C_6 -アルケニレン、 C_2-C_6 -アルキニレン、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキレン、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニレン、

C_1-C_4 -アルキレンオキシ、 C_1-C_4 -オキシアルキレン、 C_1-C_4 -オキシアルキレンオキシまたは C_1-C_4 -チオアルキレンを表し、

Eが水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニル、(C_1-C_6 -ハロゲノアルキル)スルホニルまたはジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノスルホニルを表し、

W^1 がシアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、トリ(C_1-C_4 -アルキル)シリル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニルオキシ、(C_1-C_6 -ハロゲノアルキル)スルホニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、ペンタフルオロチオ、 $-S(O)_0R^6$ 、 $-\text{SO}_2NR^7R^8$ 、 $-\text{OSO}_2NR^7R^8$ 、 $-\text{OSO}_2N(R^6)CO_2R^6$ 、 $-\text{OSO}_2R^{12}$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、

W^2 がシアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、

トリ(C_1-C_4 -アルキル)シリル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニルオキシ、(C_1-C_6 -ハロゲノアルキル)スルホニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 $-S(O)_0R^6$ 、 $-\text{SO}_2NR^7R^8$ 、 $-\text{OSO}_2NR^7R^8$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、

nが0、1、2、3または4を表し、

Qが $-\text{CO}_2R^9$ 、 $-\text{COR}^{10}$ 、 $-\text{CONR}^7R^8$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CSNH}_2$ 、 $-S(O)_0R^6$ 、

$-\text{SO}_2NR^7R^8$ 、 $-\text{PO}(\text{OR}^{11})_2$ 、窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2~4個のヘテロ原子を有する5~7員の飽和もしくは不飽和複素環を表し、

Qがさらに $-\text{CO}_2R^{13}$ または $-\text{CONR}^{14}R^{15}$ を表し、

oが0、1または2を表し、

R^6 が水素、 C_1-C_6 -アルキルまたは C_1-C_6 -ハロゲノアルキルを表し、

R^7 および R^8 が互いに独立して各々が水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルまたは C_1-C_6 -ハロゲノアルキルを表すか、または一緒になってアルキレ

10

20

30

40

50

ンを表し、

R^9 が水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、ベンジルまたはフェニルを表し、

R^{10} が $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルまたはベンジルを表し、

R^{11} が $C_1 - C_6$ - アルキルまたはフェニルを表し、

R^{12} が $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、ベンジルまたはフェニルを表し、

R^{13} が水素を表し；シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキコキシカルボニルおよび 2-ピロリジノンよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーないしトリ置換された $C_1 - C_6$ - アルキルを表し； $C_1 - C_4$ - アルキル、フェニルおよびハロゲノフェニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりアミノ基上で置換されてもよいアミノカルボニル $C_1 - C_6$ - アルキルを表し； $C_2 - C_8$ - アルケニルまたはフェニル $C_2 - C_6$ - アルケニルを表し；各々の場合にハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシおよび

10

$C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキコシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりフェニル環上でモノーないしテトラ置換されてもよいフェニル- $C_1 - C_4$ - アルキルまたはフェノキシ- $C_1 - C_4$ - アルキルを表し；各々の場合に $C_1 - C_4$ - アルキルによりシクロアルキル環上でモノーないしトリ置換されもよい $C_3 - C_6$ - シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ - シクロアルキル- $C_1 - C_4$ - アルキルを表し；各々が 0～4 個の窒素原子、0～2 個の酸素原子および 0～2 個の硫黄原子から選択される 1～4 個のヘテロ原子を含む 5-もしくは 6-員の飽和もしくは不飽和のヘテロシクリルまたはヘテロシクリル- $C_1 - C_4$ - アルキル（特に、フリル、チエニル、ピリジニル、フルフリル、テニルまたはピリジニルメチル）を表し、ここで複素環は各々の場合にハロゲンにより置換されてもよく；あるいはテトラヒドロナフチルまたはインダニルを表し、

20

R^{14} および R^{15} が互いに独立して水素、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルまたは $C_1 - C_6$ - アルコキシ- $C_1 - C_6$ - アルキルを表し；各々の場合にハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルおよび $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりフェニル環上でモノーないしテトラ置換されてもよいフェニルまたはフェニル- $C_1 - C_4$ - アルキルを表し；各々の場合にハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルおよび $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりシクロアルキル環上でモノーないしトリ置換されてもよい $C_3 - C_6$ - シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ - シクロアルキル- $C_1 - C_4$ - アルキルを表し；各々の場合に 0～4 個の窒素原子、0～2 個の酸素原子および 0～2 個の硫黄原子から選択される 1～4 個のヘテロ原子を有する 5-もしくは 6-員の飽和もしくは不飽和のヘテロシクリルまたはヘテロシクリル $C_1 - C_4$ - アルキル（特に、フリル、チエニル、テトラヒドロフリル、フルフリル、テニル、テトラヒドロフリルメチル、チアゾリル）を表し、ここで複素環は各々の場合にハロゲンまたは $C_1 - C_4$ - アルキコキシカルボニルで置換されてもよく；

30

R^{14} および R^{15} はさらに一緒になって $C_1 - C_4$ - アルキレンオキシ- $C_1 - C_4$ - アルキレンまたは $C_1 - C_4$ - アルキレンチオ- $C_1 - C_4$ - アルキレンを表す、

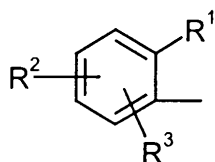
40

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】

Ar^1 が基

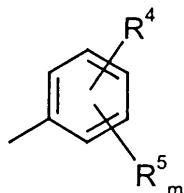
【化 6】



を表し、そして

Ar^2 が基

【化 7】



を表し、

ここで、

m が 0、1 または 2 を表し、

R^1 がフッ素、塩素、臭素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルコキシ、各々の場合にフッ素—もしくは塩素—により置換された $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキルまたは

$\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルコキシを表し、

R^2 および R^3 が互いに独立して各々が水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルコキシ、各々の場合にフッ素—もしくは塩素—により置換された $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキルまたは $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルコキシを表し、

R^4 が塩素、臭素、ヨウ素またはアリール環のオルト—もしくはパラ—位に位置する以下の基の 1 つ

(l) - X - A

(m) - B - Z - D

(n) - Y - E

を表し、

R^5 がフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、 $-\text{CONH}_2$ 、

$-\text{CSNH}_2$ 、ニトロ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキルカルボニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキコシ、各々の場合にフッ素—もしくは塩素—により置換された

$\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキルもしくは $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルコキシ、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、

$-\text{OSO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{NHCO}_2\text{R}^6$ 、 $-\text{B}(\text{OH})_2$ または 2 - (4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキソボロラン) を表し、

X が直接結合、酸素、硫黄、 $-\text{SO}_2$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、オキシスルホニル (OSO_2)、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - アルキレン、 $\text{C}_2 - \text{C}_4$ - アルケニレン、 $\text{C}_2 - \text{C}_4$ - アルキニレン、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - アルキレンオキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - オキシアルキレン、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - オキシアルキレンオキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - チオアルキレン、シクロプロピレンまたはオキシラニレンを表し、

A が各々が場合により W^1 のリストからの基でモノ—ないしトリ—置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはテトラヒドロナフチルを表すか、あるいは 1 もしくは 2 個の芳香族環および 0 ~ 4 個の窒素原子、0 ~ 2 個の酸素原子および 0 ~ 2 個の硫黄原子から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み且つ場合により W^2 のリストからの基でモノ—ないしトリ—置換されていてもよい 5 - ないし 10 - 員のヘテロシクリル (特にテトラゾリル

10

20

30

40

50

、フリル、ベンゾフリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピロリル、インドリル、オキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソキサジル、イミダジル、ピラジル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアジル、キノリニルまたはイソキノリニル)を表し、

Bが場合により W^1 のリストからの基でモノーもしくはジー置換されていてもよいp-フェニレンを表し、

Zが $-(CH_2)_n-$ 、酸素または $-S(O)_o-$ を表し、

Dが水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、ジ(C_1-C_4 -アルキル)アミノスルホニル、各々の場合にフッ素ーもしくは塩素ーにより置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルまたは C_1-C_4 -アルキルスルホニルを表し、

Yが直接結合、酸素、硫黄、 $-SO_2-$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキレン、 C_2-C_6 -アルケニレン、 C_2-C_6 -アルキニレン；各々の場合にフッ素ーもしくは塩素ーにより置換された C_1-C_6 -アルキレンもしくは C_2-C_6 -アルケニレン； C_1-C_4 -アルキレンオキシ、 C_1-C_4 -オキシアルキレン、 C_1-C_4 -オキシアルキレンオキシまたは C_1-C_4 -チオアルキレンを表し、

Eが水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、ジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノスルホニル、各々の場合にフッ素ーもしくは塩素ーにより置換された C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルまたは C_1-C_6 -アルキルスルホニルを表し、

W^1 がシアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ホルミル、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、各々の場合にフッ素ーもしくは塩素ーにより置換された C_1-C_4 -アルキルもしくは C_1-C_4 -アルコキシ、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニルオキシ、(C_1-C_4 -ハロゲノアルキル)スルホニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2R^{12}$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、

W^2 がシアノ、フッ素、塩素、臭素、ホルミル、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、各々の場合にフッ素ーもしくは塩素ーにより置換された C_1-C_4 -アルキルもしくは C_1-C_4 -アルコキシ、 C_2-C_6 -ハロゲノアルケニルオキシ、 $-OSO_2CF_3$ 、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、

nが0、1、2または3を表し、

Qが $-CO_2R^9$ 、 $-COR^{10}$ 、 $-CONR^7R^8$ 、 $-CN$ 、 $-PO(OR^{11})_2$ 、窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2~4個のヘテロ原子を有する5~7員の飽和もしくは不飽和複素環(特に、ジヒドロジオキサジン、オキサゾリン、チアゾリン、イミダゾリン、テトラゾール)を表し、

Qがさらに $-CO_2R^{13}$ または $-CONR^{14}R^{15}$ を表し、

oが0、1または2を表し、

R^6 が C_1-C_6 -アルキルまたは各々の場合にフッ素ーもしくは塩素ーにより置換されたメチルまたはエチルを表し、

R^7 および R^8 が互いに独立して各々が水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、各々の場合にフッ素ーもしくは塩素ーにより置換された C_1-C_6 -アルキルを表すか、または一緒になって C_4-C_5 -アルキレンを表し、

R^9 が水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、フッ素ーもしくは塩素ーにより置換された C_1-C_6 -アルキル、ベンジルまたはフェニルを表し、

R^{10} が C_1-C_6 -アルキルまたはフッ素ーもしくは塩素ーにより置換された C_1-C_6 -アルキルを表し、

R^{11} が C_1-C_4 -アルキルまたはフェニルを表し、

10

20

30

40

50

$R^{1\ 2}$ が $C_1 - C_4$ -アルキルを表すか、またはフッ素-もしくは塩素-により置換された $C_1 - C_4$ -アルキルを表し、

$R^{1\ 3}$ が水素を表し；シアノ、ニトロ、メトキシ、メトキシカルボニルおよび2-ピロリジノンよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノ-もしくはジ置換された $C_1 - C_4$ -アルキルを表し； $C_1 - C_4$ -アルキル、フェニルおよびハロゲノフェニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりアミノ基上で置換されてもよいアミノカルボニル $C_1 - C_4$ -アルキルを表し； $C_2 - C_6$ -アルケニルまたはフェニル $C_2 - C_5$ -アルケニルを表し；各々の場合にフッ素、塩素、メチル、メトキシおよびトリフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりフェニル環上でモノ-ないしトリ置換されてもよいフェニル- $C_1 - C_4$ -アルキルまたはフェノキシ- $C_1 - C_4$ -アルキルを表し；各々の場合にメチルによりシクロアルキル環上でモノ-ないしトリ置換されもよい $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキルを表し；各々の場合に塩素により複素環上で置換されていもよいフリル、チエニル、ピリジニル、フルフリル、テニルまたはピリジニルメチルを表し；あるいはテトラヒドロナフチルまたはインダニルを表し、

10

$R^{1\ 4}$ が水素を表し、

$R^{1\ 5}$ が $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルまたは $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキルを表し；各々の場合にフッ素、塩素、メチル、メトキシおよびトリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりフェニル環上でモノ-ないしテトラ置換されてもよいフェニルまたはフェニル- $C_1 - C_4$ -アルキルを表し；各々の場合にフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりシクロアルキル環上でモノ-ないしトリ置換されてもよい $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキルを表し；フリル、チエニル、テトラヒドロフリル、フルフリル、テニル、テトラヒドロフリルメチル、チアゾリルまたは $C_1 - C_4$ -アルキコシカルボニルで置換されたチアゾリルを表し；

20

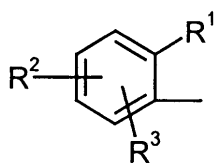
$R^{1\ 4}$ および $R^{1\ 5}$ はさらに一緒にモルホリノまたはチオモルホリノを表す、
請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項4】

Ar^1 が基

30

【化8】

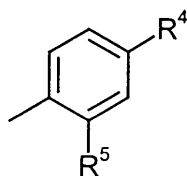


を表し、そして

Ar^2 が基

【化9】

40



を表し、

ここで、

R^1 がフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキ

50

シ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシまたは*tert*-ブトキシを表し、
 R^2 および R^3 が互いに独立して各々が水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-
 プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチ
 ル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブト
 キシまたは*tert*-ブトキシを表し、
 R^4 が塩素、臭素または以下の基の1つ

(l) $-X-A$

(m) $-B-Z-D$

(n) $-Y-E$

を表し、

R^5 がフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、メチ
 ルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ
 、トリフルオロメチルチオ、 $-OSO_2CF_3$ 、 $-OSO_2NMe_2$ または $-SO_2CF_3$
 $_3$ を表し、

R^5 が水素を表し、

Xが直接結合、酸素、硫黄、 $-SO_2-$ 、カルボニル、 $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、
 $-CH=CH-$ (EまたはZ)、 $-C\equiv C-$ 、 $-CH_2O-$ 、 $-(CH_2)_2O-$ 、 $-O$
 CH_2- 、 $-SCH_2-$ 、 $-S(CH_2)_2-$ 、 $-OCH_2O-$ または $-O(CH_2)_2$
 $O-$ を表し、

Aが場合により W^1 のリストからの基でモノーもしくはジ置換されていてもよいフェニル
 を表すか、あるいは各々が場合により W^2 のリストからの基でモノーもしくはジ置換され
 ていてもよいテトラゾリル、フリル、ベンゾフリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピロリ
 ル、インドリル、オキサゾリル、ベンズオキサゾリル、イソキサジル、イミダジル、ピラ
 ジル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジ
 ニルまたはトリアジルを表し、

Bが場合により W^1 のリストからの基でモノ置換されていてもよい*p*-フェニレンを表し
 、

Zが酸素、硫黄または $-SO_2-$ を表し、

Dが水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*
ec-ブチル、*tert*-ブチル、2-プロペニル、ブテニル、プロパルギル、ブチニル
 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CClF_2$ 、 $-CF_2CHFCl$ 、 $-CF_2CH_2F$ 、 $-C$
 F_2CCl_3 、 $-CH_2CF_3$ 、
 $-CF_2CHF CF_3$ 、 $-CH_2CF_2H$ 、 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2H$ 、
 $-CF_2CHF CF_3$ 、 $-SO_2CF_3$ 、 $-SO_2(CF_2)_3CF_3$ または $-SO_2N$
 Me_2 を表し、

Yが直接結合、酸素、硫黄、 $-SO_2-$ 、カルボニル、 $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、
 $-CH=CH-$ (EまたはZ)、 $-C\equiv C-$ 、 $-CH_2O-$ 、 $-(CH_2)_2O-$ 、 $-O$
 CH_2- 、 $-SCH_2-$ 、 $-S(CH_2)_2-$ 、 $-OCH_2O-$ または $-O(CH_2)_2$
 $O-$ を表し、

Eが水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*
ec-ブチル、*tert*-ブチル、2-プロペニル、ブテニル、プロパルギル、ブチニル
 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CClF_2$ 、 $-CF_2CHFCl$ 、 $-CF_2CH_2F$ 、 $-C$
 F_2CCl_3 、 $-CH_2CF_3$ 、
 $-CF_2CHF CF_3$ 、 $-CH_2CF_2H$ 、 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2H$ 、
 $-CF_2CHF CF_3$ 、 $-SO_2CF_3$ 、 $-SO_2(CF_2)_3CF_3$ または $-SO_2N$
 Me_2 を表し、

W^1 がシアノ、フッ素、塩素、臭素、ホルミル、ニトロ、メチル、エチル、*n*-プロピル
 、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、メトキ
 シ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシ、*te*
rt-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、

10

20

30

40

50

$-\text{CClF}_2$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{F}$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{SCHF}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{CHF}_2$ 、

$-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SOCHF}_2$ 、 $-\text{SOCF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NMe}_2$ 、 $-\text{OSO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 、 $-\text{COCH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $-\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{NMe}$ 、 $-\text{C}(\text{Me})=\text{N}-\text{O}(\text{Et})$ または $-\text{C}(\text{Et})=\text{N}-\text{OMe}$ を表し、

W^2 がシアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*tert*-ブチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{COCH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NMe}_2$ 、 $-\text{OSO}_2\text{NMe}_2$ 、 $-\text{C}(\text{Me})=\text{N}-\text{O}(\text{Et})$ または $-\text{C}(\text{Et})=\text{N}-\text{OMe}$ を表し、

Q が $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2$ -*n*-プロピル、 $-\text{CO}_2$ -イソプロピル、 $-\text{CO}_2$ -*n*-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -イソブチル、 $-\text{CO}_2$ -*sec*-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -*tert*-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -*n*-ペンチル、 $-\text{CO}_2$ -ネオペンチル、 $-\text{CO}_2$ -*sec*-イソアミル、 $-\text{CO}_2$ -ペンタン-3-イル、 $-\text{CO}_2$ -シクロペンチル、 $-\text{CO}_2$ -*n*-ヘキシル、 $-\text{CO}_2$ -シクロヘキシル、 $-\text{CO}_2$ -トリフルオロエチル、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $-\text{CO}_2\text{Ph}$ 、 $-\text{COCH}_3$ 、 $-\text{COCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}-n$ -プロピル、 $-\text{CONHMe}$ 、 $-\text{CONHEt}$ 、 $-\text{CONH}(n\text{-プロピル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{イソプロピル})$ 、 $-\text{CONH}(n\text{-ブチル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{tert-ブチル})$ 、 $-\text{CONH}(n\text{-ペンチル})$ 、 $-\text{CONH}(n\text{-ヘキシル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{シクロヘキシル})$ 、 $-\text{CONMe}_2$ 、 $-\text{CONEt}_2$ 、 $-\text{CON}(n\text{-プロピル})_2$ 、 $-\text{CON}(\text{イソプロピル})_2$ 、 $-\text{CON}(n\text{-ブチル})_2$ 、 $-\text{CON}(n\text{-ペンチル})_2$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})\text{Et}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})n\text{-プロピル}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})n\text{-ブチル}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})n\text{-ペンチル}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{PO}(\text{OMe})_2$ 、ピロリジノカルボニル、ピペリジノカルボニル、 $-\text{PO}(\text{OEt})_2$ 、 $-\text{PO}(\text{OPh})_2$ 、ジヒドロジオキサジニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリルまたはテトラゾリルを表し、

Q がさらに $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NO}_2$ 、

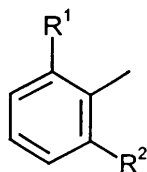
$-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、2-メトキシカルボニル-*n*-プロピルオキシカルボニル、3-(2-オキソ-1-ピロリジニル)-*n*-プロピルオキシカルボニル、*N*-4-フルオロフェニル-*N*-イソプロピル-アミノ-2-オキソ-エチルオキシカルボニル、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-\text{Ph}$ 、2-クロロベンジルオキシカルボニル、3-クロロベンジルオキシカルボニル、4-クロロベンジルオキシカルボニル、1-フェニルエチルオキシカルボニル、3-フェニルプロピルオキシカルボニル、2-フェノキシエチルオキシカルボニル、4-メチルシクロヘキシルオキシカルボニル、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル、1-シクロヘキシルエチルオキシカルボニル、3-フルフリルオキシカルボニル、2-テニルオキシカルボニル、3-テニルオキシカルボニル、2-ピリジニルメチルオキシカルボニル、3-ピリジニルメチルオキシカルボニル、6-クロロ-3-ピリジニルメチルオキシカルボニル、1-テトラヒドロナフチルオキシカルボニル、1-インダニルオキシカルボニル、 $-\text{CON}(\text{H})\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、メトキシエチルアミノカルボニル、4-トリフルオロメトキシフェニルアミノカルボニル、ベンジル-アミノカルボニル、2-クロロベンジル-アミノカルボニル、3-クロロベンジル-アミノカルボニル、4-クロロベンジル-アミノカルボニル、3-メチルベンジル-アミノカルボニル、4-メチルベンジル-アミノカルボニル、2,4-ジクロロベンジル-アミノカルボニル、2-メトキシベンジル-アミノカルボニル、2,3-ジメトキシベンジル-アミノカルボニル、3,5-ジメチルベンジル-アミノカルボニル、2,4-ジフルオロベンジル-アミノカルボニル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル-アミノカルボニル、シクロヘキシルメ

チルーアミノカルボニル、2-テニルーアミノカルボニル、2-テトラヒドロフリルメチルーアミノカルボニル、2-チアゾリルーアミノカルボニル、5-メトキシカルボニルー2-チアゾリルーアミノカルボニルまたはモルホリノカルボニルを表す、
請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項5】

Ar¹が基

【化10】

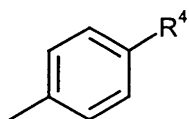


10

を表し、

Ar²が基

【化11】



20

を表し、

R¹がフッ素または塩素を表し、

R²が水素、塩素またはフッ素を表し、

R⁴がB-Z-Dを表し、

Bがp-フェニレンを表し、

Zが酸素または硫黄を表し、

Dが-CF₃を表し、

Qが-CO₂CH₃、-CO₂CH₂CH₃、-CO₂-n-プロピル、-CO₂-イソプロピル、-CO₂-n-ブチル、-CO₂-イソブチル、-CO₂-sec-ブチル、
-CO₂-tert-ブチル、-CO₂-n-ペンチル、-CO₂-ネオペンチル、-CO₂-sec-イソアミル、-CO₂-ペンタン-3-イル、-CO₂-シクロペンチル、
-CO₂-n-ヘキシル、-CO₂-シクロヘキシル、-CONHMe、-CONHEt、
-CONH(n-プロピル)、-CONH(イソプロピル)、-CONH(n-ブチル)、
-CONH(tert-ブチル)、-CONH(n-ペンチル)、-CONH(n-ヘキシル)、
-CONH(シクロヘキシル)、-CONMe₂、-CONEt₂、-CON(n-プロピル)₂、
-CON(イソプロピル)₂、-CON(n-ブチル)₂、-CON(n-ペンチル)₂、
-CON(Me)Et、-CON(Me)n-プロピル、-CON(Me)n-ブチル、
-CON(Me)n-ペンチル、-CN、ピロリジノカルボニルまたはピペリジノカルボニルを表し、

30

40

Qがさらに-CO₂H、-CO₂CH₂CN、-CO₂(CH₂)₂CN、-CO₂(CH₂)₃CN、
-CO₂CH₂C(CH₃)₂NO₂、-CO₂(CH₂)₂OCH₃、
2-メトキシカルボニループロピルオキシカルボニル、3-(2-オキソ-1-ピロリジニル)プロピルオキシカルボニル、
N-4-フルオロフェニル-N-イソプロピルーアミノ-2-オキソ-エチルオキシカルボニル、
-CO₂(CH₂)₃CH=CH₂、-CO₂(CH₂)₂C(CH₃)=CH₂、-CO₂CH₂CH=CH-Ph、
2-クロロベンジルオキシカルボニル、3-クロロベンジルオキシカルボニル、
4-クロロベンジルオキシカルボニル、1-フェニルエチルオキシカルボニル、
3-フェニルプロピルオキシカルボニル、2-フェノキシ-エチルオキシカルボニル、
4-メチルシクロヘキシルオキシカルボニル、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル、

50

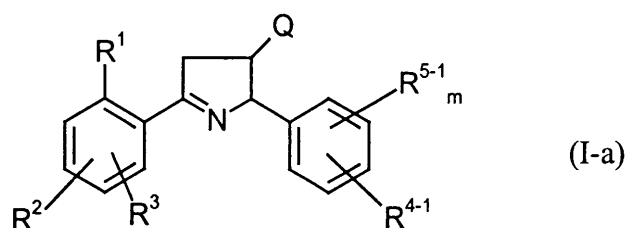
ルボニル、1-シクロヘキシルエチルオキシカルボニル、3-フルフリルオキシカルボニル、2-テニルオキシカルボニル、3-テニルオキシカルボニル、2-ピリジニルメチルオキシカルボニル、3-ピリジニルメチルオキシカルボニル、6-クロロ-3-ピリジニルメチルオキシカルボニル、1-テトラヒドロナフチルオキシカルボニル、1-インダニルオキシカルボニル、 $-\text{CON}(\text{H})\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、メトキシエチルアミノカルボニル、4-トリフルオロメトキシフェニルアミノカルボニル、ベンジルアミノカルボニル、2-クロロベンジルアミノカルボニル、3-クロロベンジルアミノカルボニル、4-クロロベンジルアミノカルボニル、3-メチルベンジルアミノカルボニル、4-メチルベンジルアミノカルボニル、2,4-ジクロロベンジルアミノカルボニル、2-メトキシベンジルアミノカルボニル、2,3-ジメトキシベンジルアミノカルボニル、3,5-ジメチルベンジルアミノカルボニル、2,4-ジフルオロベンジルアミノカルボニル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシルアミノカルボニル、シクロヘキシルメチルアミノカルボニル、2-テニルアミノカルボニル、2-テトラヒドロフリルメチルアミノカルボニル、2-チアゾリルアミノカルボニル、5-メトキシカルボニル-2-チアゾリルアミノカルボニルを表すか、またはモルホリノカルボニルを表す、請求項1に記載の式(I)の化合物。

10

【請求項6】

式(I-a)

【化12】



20

式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、Qおよびmがそれぞれ請求項1ないし5に定義した通りであり、 R^{4-1} がAまたはB-Z-Dを表し、

30

ここでA、B、ZおよびDはそれぞれ請求項1ないし5に定義した通りであり、そして

R^{5-1} がフッ素、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、トリアルキルシリル、アルコキシカルボニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{OSO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_o\text{R}^6$ 、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{NHCO}_2\text{R}^6$ またはハロゲノアルキルアミノスルホニルを表し、

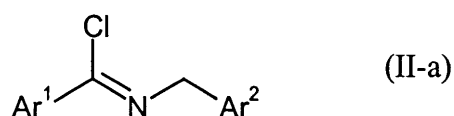
ここで、 R^6 、 R^7 、 R^8 およびoはそれぞれ請求項1ないし5に定義した通りである、の Δ^1 -ピロリン類。

【請求項7】

A-1.) 式(II-a)

40

【化13】



のイミノクロライドを、式(III)

【化 1 4】



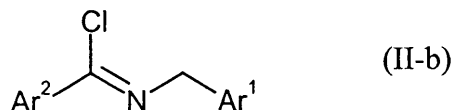
式中、

Ar¹、Ar² および Q は各々請求項 1 ないし 5 に定義した通りである、

のジボラロフィル化合物と、酸結合剤の存在下で、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させるか、あるいは

A-2.) 式 (I I-b)

【化 1 5】



のイミノクロライドを、式 (I I I)

【化 1 6】



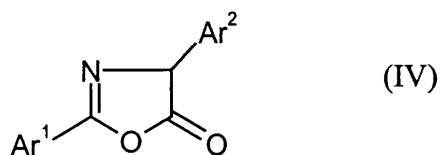
式中、

Ar¹、Ar² および Q は各々請求項 1 ないし 5 に定義した通りである、

のジボラロフィル化合物と、酸結合剤の存在下で、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させるか、あるいは

B.) 式 (I V)

【化 1 7】



のオキサゾリノン、式 (I I I)

【化 1 8】



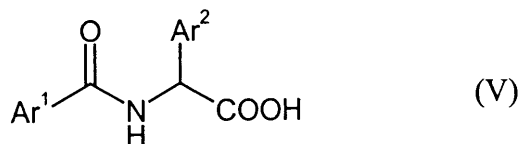
式中、

Ar¹、Ar² および Q は各々請求項 1 ないし 5 に定義した通りである、

のジボラロフィル化合物と、適当ならば希釈剤の存在下で反応させるか、あるいは

C.) 式 (V)

【化 1 9】



のカルボン酸を、式 (I I I)

10

20

30

40

【化 2 0】



式中、

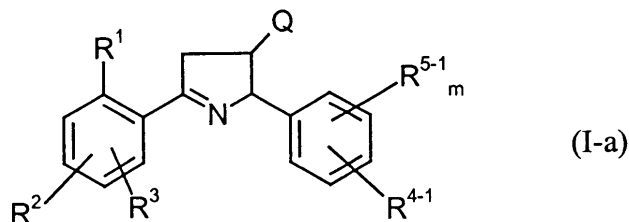
A r¹、A r² および Q は請求項 1 ないし 5 に定義した通りである、

のジボラロフィル化合物と、無水酢酸の存在下で、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させるか、あるいは

D.) 式 (I - a)

【化 2 1】

10



式中、

R¹、R²、R³、Q および m は各々請求項 1 ないし 5 に定義した通りであり、

20

R⁴⁻¹ は A または B - Z - D を表し、

ここで、

A、B、Z および D は各々請求項 1 ないし 5 に定義した通りであり、

そして

R⁵⁻¹ はフッ素、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、トリアルキルシリル、アルコキシカルボニル、-CONR⁷R⁸、-OSO₂NR⁷R⁸、-S(O)₀R⁶、-NR⁷R⁸、-NHCO₂R⁶ またはハロゲノアルキルアミノスルホニルを表し、

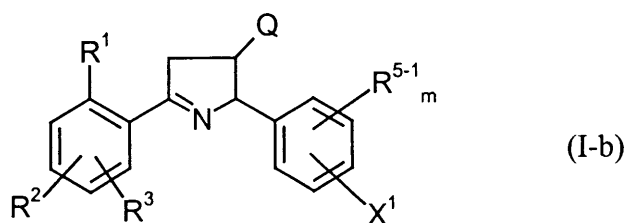
ここで

R⁶、R⁷、R⁸ および o は各々請求項 1 ないし 5 に定義した通りである、

30

の Δ¹-ピロリンを式 (I - b)

【化 2 2】



40

式中、

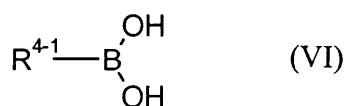
R¹、R²、R³、R⁵⁻¹、Q および m は各々請求項 1 ないし 5 に定義した通りであり

、そして

X¹ は Cl、Br、I または -OSO₂CF₃ を表す、

の化合物を、式 (V I)

【化 2 3】



50

式中、

R^{4-1} は本請求項で定義した通りである、

のボロン酸と、触媒の存在下で、適当ならば酸結合剤、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させることにより得、

あるいは

式 (I-a) の化合物を、式 (I-b)

式中、

X^1 は 2-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキソボロラン) を表す、
の化合物を、式 (VII)

T-A (VII)

10

式中、

A は請求項 1 ないし 5 に定義した通りであり、そして

T は Cl、Br、I または $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ を表す、

の (ヘテロ) サイクルと、触媒の存在下で、適当ならば酸結合剤の存在下で、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させることにより得、

ことを特徴とする請求項 1 ないし 5 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物の製造法。

【請求項 8】

増量剤および／または表面活性剤に加えて、請求項 1 ないし 5 のいずれかに記載の少なくとも 1 種の式 (I) の化合物を含んでなることを特徴とする有害生物防除剤。

【請求項 9】

20

有害生物を防除するための請求項 1 ないし 5 のいずれかに記載の式 (I) の化合物の使用。

【請求項 10】

請求項 1 ないし 5 のいずれかに記載の式 (I) の化合物を有害生物および／またはそれらの生育場所に作用させることを特徴とする有害生物の防除法。

【請求項 11】

請求項 1 ないし 5 のいずれかに記載の式 (I) の化合物を増量剤および／または表面活性剤と混合することを特徴とする有害生物防除剤の調製法。

【請求項 12】

有害生物防除剤を調製するための請求項 1 ないし 5 のいずれかに記載の式 (I) の化合物の使用。 30

【発明の詳細な説明】

【0001】

本発明は Δ^1 -ピロリン類、特にそれらの複数の製造法およびそれらの有害生物防除剤としての使用に関する。

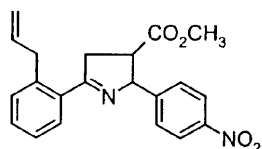
【0002】

これまでわずかな 4-置換 2, 5-ビス-アリール- Δ^1 -ピロリン類しか開示されていない：

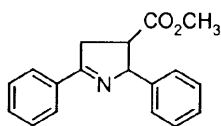
【0003】

【化 24】

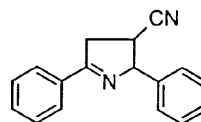
40



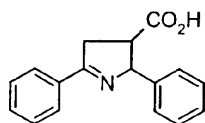
A. Padwa and A. Ku,
J. Am. Chem. Soc. 1978, **100**, 2181



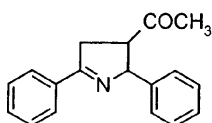
A. Padwa and J. Smolanoff,
J. Am. Chem. Soc. 1971, **93**, 548



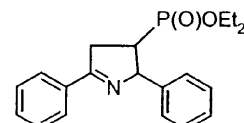
A. Padwa et al,
J. Am. Chem. Soc. 1973, **95**, 1945



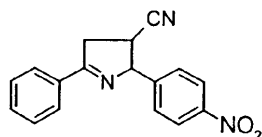
R. Huisgen et al.,
Chem. Ber. 1970, **103**, 2368



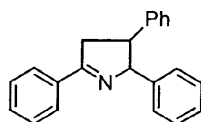
O. Tsuge et al.,
Bull. Chem. Soc. Jpn.
1987, **60**, 3347



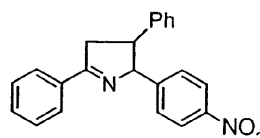
Gakis, N. et al., Helv. Chim.
Acta 1975, **68**, 748



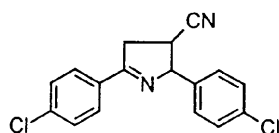
R. Huisgen et al.,
Chem. Ber. 1972, **105**, 1258



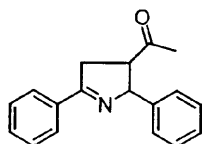
Padwa et al., Tet. Lett.
1972, 4087



Huisgen et al., Tet. Lett.
1966, 3603



A. R. Katritzky et al.,
Synthesis 1991, **10**, 863



O. Tsuge, Bull. Chem. Soc. Jpn.
1987, **60**, 3347

10

20

30

40

【0004】

それらが有害生物防除剤として適当であるかどうかは知られていない。

【0005】

国際公開第00/21958号、同第99/59968号、同第99/59967号および同第98/22438号明細書は、他の Δ^1 -ピロリン、およびそれらが有害生物防除剤としての使用に適するという事実を開示する。

【0006】

しかし、特に特定の生物および/または低い施用率では、このような従来技術の化合物の効力および/または作用期間が使用の全分野で完全に満足されるわけではない。

【0007】

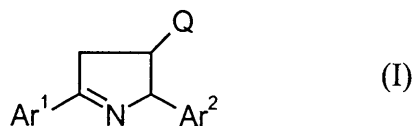
しかしながら、今日の有害生物防除剤は、例えば効力、作用期間、活性スペクトル、使用スペクトル、毒性、他の活性化合物との組み合わせ、配合補助剤との組み合わせまたは合成に合わなければならないという多くの要件から、ならびに耐性の発生により、そのような物質の開発が完結するとは決して考えられず、そして少なくとも幾つかの観点において、既知の化合物よりも利点を提供する新規な化合物の必要性は永遠に大きい。

【0008】

したがって、本発明は、式(I)

【0009】

【化25】



【0010】

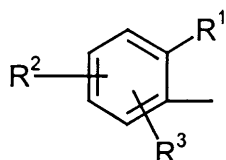
式中、

Ar¹ は基

【0011】

【化26】

10



【0012】

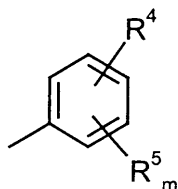
を表し、そして

Ar² は基

【0013】

【化27】

20



【0014】

を表し、

ここで、

mは0、1、2、3または4を表し、

R¹ はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、アルコキシアルキル、-S(O)₀R⁶ または-NR⁷R⁸ を表し、R² および R³ は互いに独立して各々が水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、アルコキシアルキル、-S(O)₀R⁶ または-NR⁷R⁸ を表し、R⁴ はハロゲンまたは以下の基の1つ

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

を表し、

R⁵ はハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、-CONH₂、-CSNH₂、ニトロ、アルキル、アルキルカルボニル、アルキコシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルスルホニルオキシ、トリアルキルシリル、アルコキシカルボニル、-CONR⁷R⁸、-OSO₂NR⁷R⁸、-S(O)₀R⁶、-NR⁷R⁸、-NHCO₂R⁶、ハロゲノアルキルアミノスルホニル、ビスアルコキシボランまたは-B(OH)₂を表し、

Xは直接結合、酸素、-S(O)₀、-NR⁶、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、オキシスルホニル(OSO₂)、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アルキレンオキシ、オキシアルキレン、オキシアルキレンオキシ、チオアルキレン、シ

30

40

50

クロプロピレンまたはオキシラニレンを表し、

Aは場合により各々が W^1 のリストからの基でモノーもしくはポリー置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはテトラヒドロナフチルを表すか、あるいは窒素、酸素および硫黄よりなる群からの1個以上のヘテロ原子を含み且つ場合により W^2 のリストからの基でモノーもしくはポリー置換されていてもよい5-ないし10-員の飽和もしくは不飽和ヘテロシクリルを表し、

Bは場合により W^1 のリストからの基でモノーもしくはジ-置換されていてもよいp-フェニレンを表し、

Zは $-(CH_2)_n-$ 、酸素または $-S(O)_o-$ を表し、

Dは水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルケニル、ハロゲノアルキルスルホニルまたはジアルキルアミノスルホニルを表し、 10

Yは直接結合、酸素、硫黄、 $-SO_2-$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アルキレンオキシ、オキシアルキレン、オキシアルキレンオキシ、チオアルキレン、ハロゲノアルキレンまたはハロゲノアルケニレンを表し、

Eは水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルケニル、ハロゲノアルキルスルホニルまたはジアルキルアミノスルホニルを表し、

W^1 はシアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、アルキル、トリアルキルシリル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、ハロゲノアルキルスルホニルオキシ、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ペンタフルオロチオ、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$ 、 $-OSO_2R^{12}$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、 20

W^2 はシアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、アルキル、トリアルキルシリル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、ハロゲノアルキルスルホニルオキシ、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、

nは0、1、2、3または4を表し、

Qは $-CO_2R^9$ 、 $-COR^{10}$ 、 $-CONR^7R^8$ 、 $-CN$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CSNH_2$ 、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-PO(OR^{11})_2$ 、窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2~4個のヘテロ原子を含む5~7員の飽和もしくは不飽和複素環を表し、 30

Qはさらに $-CO_2R^{13}$ または $-CONR^{14}R^{15}$ を表し、

oは0、1または2を表し、

R^6 は水素、アルキルまたはハロゲノアルキルを表し、

R^7 および R^8 は互いに独立して水素、アルキル、シクロアルキル、ハロゲノアルキルを表すか、または一緒になってアルキレンを表し、

R^9 は水素、アルキル、シクロアルキル、ハロゲノアルキル、アラルキルまたはフェニルを表し、

R^{10} はアルキル、ハロゲノアルキルまたはアラルキルを表し、 40

R^{11} はアルキルまたはアリールを表わし、

R^{12} はアルキル、ハロゲノアルキル、アラルキルまたはアリールを表し、

R^{13} は水素を表し；モノーもしくはポリー置換されたアルキルを表し；場合により置換されていてもよいアミノカルボニルアルキルを表し；アルケニルまたはフェニルアルケニルを表し；各々の場合に場合により置換されていてもよいフェニルアルキルまたはフェノキシアルキルを表し；各々の場合に場合により置換されていてもよいシクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルを表し；各々が窒素、酸素および硫黄よりなる群から選択される1~4個のヘテロ原子を含む飽和もしくは不飽和のヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルを表し；あるいはテトラヒドロナフチルまたはインダニルを表し、

R^{14} および R^{15} は互いに独立して水素、ハロゲノアルキルまたはアルコキシアルキル 50

を表し；各々の場合に場合により置換されていてもよいフェニルまたはフェニルアルキルを表し；各々の場合に場合により置換されていてもよいシクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルを表し；各々の場合に場合により置換されていてもよく、各々の場合に飽和もしくは不飽和の、各々が窒素、酸素および硫黄から成る群からの1～4個のヘテロ原子を含むヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルを表し、

R^{1-4} および R^{1-5} はさらに一緒になってアルキレンオキシアルキレンまたはアルキレンチオアルキレンを表す、

の新規 Δ^1 -ピロリン類を提供する。

【0015】

置換基の種類および数に依存して、式(I)の化合物は変化する組成物中に、幾何および／または光学異性体または位置異性体またはそれらの異性体混合物として存在することができる。本発明で特許請求するのは、純粋な異性体および異性体混合物の両方である。

【0016】

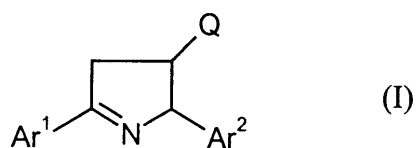
さらに、式(I)の新規化合物は、以下に記載する方法の1つにより得ることができる。

【0017】

式(I)

【0018】

【化28】



20

【0019】

式中、

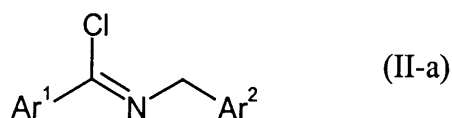
Ar^1 、 Ar^2 および Q は各々上記定義の通りである、

の Δ^1 -ピロリンは、

A-1.) 式(II-a)

【0020】

【化29】



30

【0021】

のイミノクロライドを、式(III)

【0022】

【化30】



40

【0023】

式中、

Ar^1 、 Ar^2 および Q は各々上記定義の通りである、

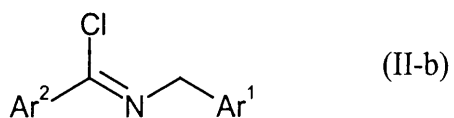
のジポラロフィル化合物(dipolarophilic compound)と、酸結合剤の存在下で、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させるか、あるいは

A-2.) 式(II-b)

【0024】

【化31】

50



【 0 0 2 5 】

のイミノクロライドを、式 (I I I)

【 0 0 2 6 】

【 化 3 2 】



10

【 0 0 2 7 】

式中、

A r ¹、A r ² および Q は各々上記定義の通りである、

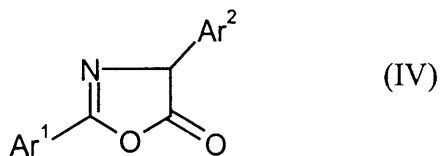
のジボラロフィル化合物と、酸結合剤の存在下で、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させるか、あるいは

B.) 式 (I V)

【 0 0 2 8 】

【 化 3 3 】

20



【 0 0 2 9 】

のオキサゾリノン、式 (I I I)

【 0 0 3 0 】

【 化 3 4 】

30



【 0 0 3 1 】

式中、

A r ¹、A r ² および Q は各々上記定義の通りである、

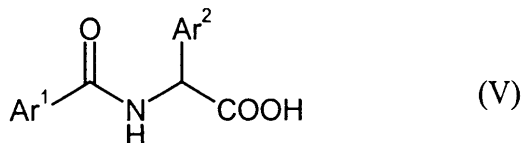
のジボラロフィル化合物と、適当ならば希釈剤の存在下で反応させるか、あるいは

C.) 式 (V)

【 0 0 3 2 】

【 化 3 5 】

40

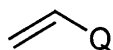


【 0 0 3 3 】

のカルボン酸を、式 (I I I)

【 0 0 3 4 】

【 化 3 6 】



(III)

【0035】

式中、

Ar¹、Ar² および Q は各々上記定義の通りである、

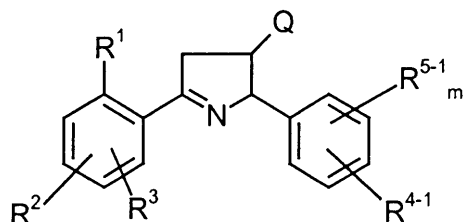
のジボラロフィル化合物と、無水酢酸の存在下で、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させることにより製造することができる。

D.) 式 (I-a)

【0036】

10

【化37】



(I-a)

【0037】

20

式中、

R¹、R²、R³、Q および m は各々上記定義の通りであり、R⁴⁻¹ は A または B-Z-D を表し、

ここで、

A、B、Z および D は各々上記定義の通りであり、

そして

R⁵⁻¹ はフッ素、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、トリアルキルシリル、アルコシカルボニル、-CONR⁷R⁸、-OSO₂NR⁷R⁸、-S(O)_oR⁶、-NR⁷R⁸、-NHCO₂R⁶ またはハロゲノアルキルアミノスルホニルを表し、

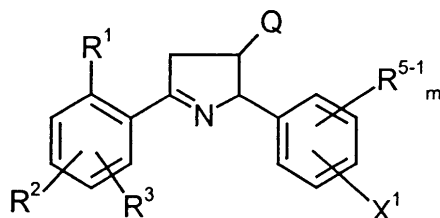
30

ここで

R⁶、R⁷、R⁸ および o は各々上記定義の通りである、の Δ¹-ピロリンは、式 (I-b)

【0038】

【化38】



(I-b)

40

【0039】

式中、

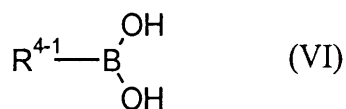
R¹、R²、R³、R⁵⁻¹、Q および m は各々、上記定義の通りであり、そしてX¹ は、Cl、Br、I または -OSO₂CF₃ を表す、

の化合物を、式 (VI)

【0040】

【化39】

50



【0041】

式中、

R^{4-1} は、上記定義の通りである、

のボロン酸と、触媒の存在下で、適当ならば酸結合剤、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させることにより、

あるいは

式 (I-b)

式中、

X^1 は 2-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキソボロラン) を表す、
の化合物を、式 (VII)

T-A (VII)

式中、

A は上記定義の通りであり、そして

T は Cl、Br、I または $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ を表す、

の (ヘテロ) サイクルと、触媒の存在下で、適当ならば酸結合剤の存在下で、そして適当ならば希釈剤の存在下で反応させることにより製造することができる。

【0042】

最後に、本発明の式 (I) の化合物は非常に良好な殺虫特性を有し、そして昆虫のような望ましくない有害生物を防除するために作物保護および材料の保護の両方に利用できることが分かった。

【0043】

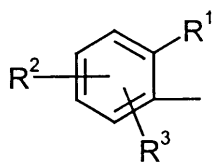
式 (I) は本発明による化合物の一般的定義を提供する。上記および以下に述べる式の下に掲げる好適な置換基または基の範囲を以下に具体的に説明する。

【0044】

Ar^1 は 好ましくは

【0045】

【化40】



【0046】

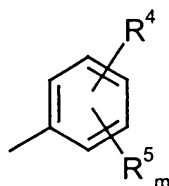
を表す。

【0047】

Ar^2 は 好ましくは

【0048】

【化41】



【0049】

を表す。

【0050】

mは好ましくは0、1、2または3を表す。

【0051】

R^1 は好ましくはハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル、 $-S(O)_0R^6$ または $-NR^7R^8$ を表す。

【0052】

R^2 および R^3 は互いに独立して各々が好ましくは水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル、 $-S(O)_0R^6$ または $-NR^7R^8$ を表す。 10

【0053】

R^4 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、またはアリール環のオルト-もしくはパラ-位に位置する以下の基の1つ

(l) $-X-A$

(m) $-B-Z-D$

(n) $-Y-E$

を表す。

【0054】

R^5 は好ましくはハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $-CONH_2$ 、 $-CSNH_2$ 、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、(C_1-C_6 -ハロゲノアルキル)スルホニルオキシ、トリ(C_1-C_6 -アルキル)-シリル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 $-CONR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ 、 $-S(O)_0R^6$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-NHCO_2R^6$ 、(C_1-C_6 -ハロゲノアルキル)アミノスルホニル、ビス(C_1-C_6 -アルコキシ)ボランまたは $-B(OH)_2$ を表す。 20

【0055】

Xは好ましくは直接結合、酸素、 $-S(O)_0$ 、 $-NR^6$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、オキシスルホニル(OSO_2)、 C_1-C_4 -アルキレン、 C_2-C_4 -アルケニレン、 C_2-C_4 -アルキニレン、 C_1-C_4 -アルキレンオキシ、 C_1-C_4 -オキシアルキレン、 C_1-C_4 -オキシアルキレンオキシ、 C_1-C_4 -チオアルキレン、シクロプロピレンまたはオキシラニレンを表す。 30

【0056】

Aは好ましくは各々が場合により W^1 のリストからの基でモノ-ないしテトラ置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはテトラヒドロナフチルを表すか、あるいは1もしくは2個の芳香族環および0~4個の窒素原子、0~2個の酸素原子および0~2個の硫黄原子よりなる群から選択される1~4個のヘテロ原子を含み且つ場合により W^2 のリストからの基でモノ-ないしテトラ置換されていてもよい5-ないし10-員のヘテロシクリル(特にテトラゾリル、フリル、ベンゾフリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピロリル、インドリル、オキサゾリル、ベンズオキサゾリル、イソキサジル、イミダジル、ピラジル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアジル、キノリニルまたはイソキノリニル)を表す。 40

【0057】

Bは好ましくは場合により W^1 のリストからの基でモノ-もしくはジ-置換されていてもよいp-フェニレンを表す。

【0058】

Zは好ましくは $-(CH_2)_n-$ 、酸素または $-(S)_0-$ を表す。

【0059】

Dは好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 50

$C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニル、($C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル) スルホニルまたはジ ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノスルホニルを表す。

【0060】

Yは好ましくは直接結合、酸素、硫黄、 $-SO_2-$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキレン、 $C_2 - C_6$ - アルケニレン、 $C_2 - C_6$ - アルキニレン、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキレン、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニレン、 $C_1 - C_4$ - アルキレンオキシ、 $C_1 - C_4$ - オキシアルキレン、 $C_1 - C_4$ - オキシアルキレンオキシまたは $C_1 - C_4$ - チオアルキレンを表す。

【0061】

Eは好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニル、($C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル) スルホニルまたはジ ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノスルホニルを表す。

【0062】

W^1 は好ましくはシアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、トリ ($C_1 - C_4$ - アルキル) シリル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニルオキシ、($C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル) スルホニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、ペンタフルオロチオ、 $-S(O)_0R^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$ 、 $-OSO_2R^{12}$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表す。

【0063】

W^2 は好ましくはシアノ、ハロゲン、ホルミル、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、トリ ($C_1 - C_4$ - アルキル) シリル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニルオキシ、($C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル) スルホニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $-S(O)_0R^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表す。

【0064】

nは好ましくは0、1、2、3または4を表す。

【0065】

Qは好ましくは $-CO_2R^9$ 、 $-COR^{10}$ 、 $-CONR^7R^8$ 、 $-CN$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CSNH_2$ 、 $-S(O)_0R^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-PO(OR^{11})_2$ 、窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2～4個のヘテロ原子を有する5～7員の飽和もしくは不飽和複素環を表す。

【0066】

Qはさらに好ましくは $-CO_2R^{13}$ または $-CONR^{14}R^{15}$ を表す。

【0067】

oは好ましくは0、1または2を表し、

R^6 は好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキルまたは $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルを表す。

【0068】

R^7 および R^8 が互いに独立して各々が好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルまたは $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルを表すか、あるいは一緒になってアルキレンを表す。

【0069】

R^9 は好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、ベンジルまたはフェニルを表す。

10

20

30

40

50

【0070】

R^{10} は好ましくは $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルまたはベンジルを表す。

【0071】

R^{11} は好ましくは $C_1 - C_6$ - アルキルまたはフェニルを表す。

【0072】

R^{12} は好ましくは $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキル、ベンジルまたはフェニルを表す。

【0073】

R^{13} は好ましくは水素を表し；シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、
 $C_1 - C_4$ - アルキコキシカルボニルおよび2-ピロリジノンよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノーないしトリ置換された $C_1 - C_6$ - アルキルを表し； $C_1 - C_4$ - アルキル、フェニルおよびハロゲノフェニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりアミノ基上で置換されてもよいアミノカルボニル- $C_1 - C_6$ - アルキルを表し； $C_2 - C_8$ - アルケニルまたはフェニル- $C_2 - C_6$ - アルケニルを表し；各々の場合にハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシおよび $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキコシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりフェニル環上でモノーないしテトラ置換されてもよい
 フェニル- $C_1 - C_4$ - アルキルまたはフェノキシ $C_1 - C_4$ - アルキルを表し；各々の場合に $C_1 - C_4$ - アルキルによりシクロアルキル環上でモノーないしトリ置換されもよい $C_3 - C_6$ - シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ - シクロアルキル- $C_1 - C_4$ - アルキルを表し；各々が0~4個の窒素原子、0~2個の酸素原子および0~2個の硫黄原子から選択される1~4個のヘテロ原子を含む5-もしくは6-員の飽和もしくは不飽和のヘテロシクリルまたはヘテロシクリル- $C_1 - C_4$ - アルキル（特に、フリル、チエニル、ピリジニル、フルフリル、テニルまたはピリジニルメチル）を表し、ここで複素環は各々の場合にハロゲンにより置換されてもよく；あるいはテトラヒドロナフチルまたはインダニルを表す。

【0074】

R^{14} および R^{15} が互いに独立して各々が好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - ハロゲノアルキルまたは $C_1 - C_6$ - アルコキシ- $C_1 - C_6$ - アルキルを表し；各々の場合でハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルおよび $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりフェニル環上でモノーないしテトラ置換されてもよいフェニルまたはフェニル- $C_1 - C_4$ - アルキルを表し；各々の場合にハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルおよび $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりシクロアルキル環上でモノーないしトリ置換されてもよい $C_3 - C_6$ - シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ - シクロアルキル- $C_1 - C_4$ - アルキルを表し；各々の場合に0~4個の窒素原子、0~2個の酸素原子および0~2個の硫黄原子から選択される1~4個のヘテロ原子を有する5-もしくは6-員の飽和もしくは不飽和のヘテロシクリルまたはヘテロシクリル- $C_1 - C_4$ - アルキル（特に、フリル、チエニル、テトラヒドロフリル、フルフリル、テニル、テトラヒドロフリルメチル、チアゾリル）を表し、ここで複素環は各々の場合でハロゲンまたは $C_1 - C_4$ - アルキコキシカルボニルで置換されてもよい。

【0075】

R^{14} および R^{15} はさらに一緒になって好ましくは $C_1 - C_4$ - アルキレンオキシ- $C_1 - C_4$ - アルキレンまたは $C_1 - C_4$ - アルキレンチオ- $C_1 - C_4$ - アルキレンを表す。

【0076】

Ar^1 は特に好ましくは基

【0077】

10

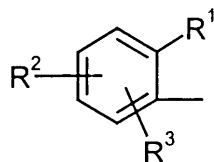
20

30

40

50

【化 4 2】



【0078】

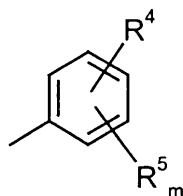
を表す。

【0079】

Ar² は特に好ましくは基

【0080】

【化 4 3】



10

20

【0081】

を表す。

【0082】

mは特に好ましくは0、1または2を表す。

【0083】

R¹ は特に好ましくはフッ素、塩素、臭素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、各々の場合でフッ素 - または塩素 - により置換されたC₁ - C₆ - アルキルまたはC₁ - C₆ - アルコキシを表す。

【0084】

R² および R³ は互いに独立して各々が特に好ましくは水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、各々の場合にフッ素 - または塩素 - により置換されたC₁ - C₆ - アルキルまたはC₁ - C₆ - アルコキシを表す。

30

【0085】

R⁴ は特に好ましくは塩素、臭素、ヨウ素、またはアリール環のオルト - もしくはパラ - 位に位置する以下の基の1つ

(l) - X - A

(m) - B - Z - D

(n) - Y - E

を表す。

【0086】

R⁵ は特に好ましくはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、-CONH₂、-CSNH₂、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルキコシ、各々の場合にフッ素 - もしくは塩素 - により置換されたC₁ - C₆ - アルキルもしくはC₁ - C₆ - アルコキシ、-OSO₂CF₃、-CONR⁷R⁸、-OSO₂NR⁷R⁸、-S(O)₀R⁶、-NR⁷R⁸、-NHCO₂R⁶、-B(OH)₂または2 - (4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキソボロラン)を表す。

40

【0087】

Xは特に好ましくは直接結合、酸素、硫黄、-SO₂、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、オキシスルホニル (OSO₂)、C₁ - C₄ - アルキレン、C₂ - C

50

C_4 - アルケニレン、 $C_2 - C_4$ - アルキニレン、 $C_1 - C_4$ - アルキレンオキシ、 $C_1 - C_4$ - オキシアルキレン、 $C_1 - C_4$ - オキシアルキレンオキシ、 $C_1 - C_4$ - チオアルキレン、シクロプロピレンまたはオキシラニレンを表す。

【0088】

Aは特に好ましくは各々が場合により W^1 のリストからの基でモノーないしトリー置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはテトラヒドロナフチルを表すか、あるいは1もしくは2個の芳香族環および0～4個の窒素原子、0～2個の酸素原子および0～2個の硫黄原子から選択される1～4個のヘテロ原子を含み且つ場合により W^2 のリストからの基でモノーないしトリ置換された5～10員のヘテロシクリル（特にテトラゾリル、フリル、ベンゾフリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピロリル、インドリル、オキサゾリル、ベンズオキサゾリル、イソキサジル、イミダジル、ピラジル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニル、トリアジル、キノリニルまたはイソキノリニル）を表す。

10

【0089】

Bは特に好ましくは場合により W^1 のリストからの基でモノーもしくはジ置換されていてもよいp-フェニレンを表す。

【0090】

Zは特に好ましくは $-(CH_2)_n-$ 、酸素または $-(S)_o-$ を表す。

【0091】

Dは特に好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ジ($C_1 - C_4$ - アルキル) アミノスルホニル、各々の場合にフッ素もしくは塩素により置換された $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルまたは $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニルを表し、

20

Yは特に好ましくは直接結合、酸素、硫黄、 $-SO_2-$ 、カルボニル、カルボニルオキシ、オキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキレン、 $C_2 - C_6$ - アルケニレン、 $C_2 - C_6$ - アルキニレン；各々の場合でフッ素もしくは塩素により置換された $C_1 - C_6$ - アルキレンもしくは $C_2 - C_6$ - アルケニレン； $C_1 - C_4$ - アルキレンオキシ、 $C_1 - C_4$ - オキシアルキレン、 $C_1 - C_4$ - オキシアルキレンオキシまたは $C_1 - C_4$ - チオアルキレンを表す。

【0092】

30

Eは特に好ましくは水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ジ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノスルホニル、各々の場合にフッ素または塩素により置換された $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルまたは $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルを表す。

【0093】

W^1 は特に好ましくはシアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ホルミル、ニトロ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、各々の場合にフッ素もしくは塩素により置換された $C_1 - C_4$ - アルキルまたは $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニルオキシ、($C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル) スルホニルオキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシカルボニル、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2R^{12}$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表し、

40

W^2 は特に好ましくはシアノ、フッ素、塩素、臭素、ホルミル、ニトロ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、各々の場合にフッ素もしくは塩素により置換された $C_1 - C_4$ - アルキルもしくは $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロゲノアルケニルオキシ、 $-OSO_2CF_3$ 、 $C_1 - C_4$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシカルボニル、 $-S(O)_oR^6$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ または $-C(R^6)=N-O(R^6)$ を表す。

【0094】

nは特に好ましくは0、1、2または3を表す。

50

【0095】

Qは特に好ましくは $-\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $-\text{COR}^{10}$ 、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{PO}(\text{OR}^{11})_2$ 、窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2～4個のヘテロ原子を有する5～7員の飽和もしくは不飽和複素環（特に、ジヒドロジオキサジン、オキサゾリン、チアゾリン、イミダゾリン、テトラゾール）を表す。

【0096】

Qはさらに特に好ましくは $-\text{CO}_2\text{R}^{13}$ または $-\text{CONR}^{14}\text{R}^{15}$ を表す。

【0097】

oは特に好ましくは0、1または2を表す。

【0098】

R^6 は特に好ましくは C_1-C_6 -アルキル、または各々の場合にフッ素もしくは塩素により置換されたメチルまたはエチルを表す。

10

【0099】

R^7 および R^8 は互いに独立して各々が特に好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、各々の場合にフッ素もしくは塩素により置換された C_1-C_6 -アルキルを表すか、あるいは一緒になって C_4-C_5 -アルキレンを表す。

【0100】

R^9 は特に好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、フッ素もしくは塩素により置換された C_1-C_6 -アルキル、ベンジルまたはフェニルを表す。

20

【0101】

R^{10} は特に好ましくは C_1-C_6 -アルキル、またはフッ素もしくは塩素により置換された C_1-C_6 -アルキルを表す。

【0102】

R^{11} は特に好ましくは C_1-C_4 -アルキルまたはフェニルを表す。

【0103】

R^{12} は特に好ましくは C_1-C_4 -アルキルを表すか、あるいはフッ素もしくは塩素により置換された C_1-C_4 -アルキルを表す。

【0104】

R^{13} は特に好ましくは水素を表し；シアノ、ニトロ、メトキシ、メトキシカルボニルおよび2-ピロリジノンよりなる群からの同一もしくは異なる置換基でモノもしくはジ置換された C_1-C_4 -アルキルを表し； C_1-C_4 -アルキル、フェニルおよびハロゲノフェニルよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりアミノ基上で置換されてもよいアミノカルボニル C_1-C_4 -アルキルを表し； C_2-C_6 -アルケニルまたはフェニル C_2-C_5 -アルケニルを表し；各々の場合にフッ素、塩素、メチル、メトキシおよびトリフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりフェニル環上でモノないしトリ置換されてもよいフェニル- C_1-C_4 -アルキルまたはフェノキシ- C_1-C_4 -アルキルを表し；各々の場合にメチルによりシクロアルキル環上でモノないしトリ置換されもよい C_3-C_6 -シクロアルキルまたは C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルを表し；各々の場合に塩素により複素環上で置換されていもよいフリル、チエニル、ピリジニル、フルフリル、テニルまたはピリジニルメチルを表し；あるいはテトラヒドロナフチルまたはインダニルを表す。

30

40

【0105】

R^{14} は特に好ましくは水素を表す。

【0106】

R^{15} は特に好ましくは C_1-C_4 -ハロゲノアルキルまたは C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルを表し；各々の場合にフッ素、塩素、メチル、メトキシおよびトリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりフェニル環上でモノないしテトラ置換されてもよいフェニルまたはフェニル- C_1-C_4 -アルキルを表し；各々の場合にフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチルお

50

よびトリフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは異なる置換基によりシクロアルキル環上でモノーないしトリ置換されてもよい $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキルを表し；フリル、チエニル、テトラヒドロフリル、フルフリル、テニル、テトラヒドロフリルメチル、チアゾリルまたは $C_1 - C_4$ -アルキコシカルボニルで置換されたチアゾリルを表す。

【0107】

R^{1-4} および R^{1-5} はさらに一緒になって特に好ましくはモルホリノまたはチオモルホリノを表す。

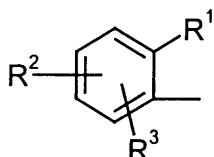
【0108】

Ar^1 は特に大変好ましくは基

10

【0109】

【化44】



【0110】

を表す。

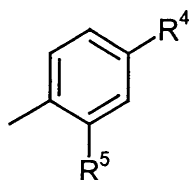
20

【0111】

Ar^2 は特に大変好ましくは基

【0112】

【化45】



30

【0113】

を表す。

【0114】

R^1 は特に大変好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシまたは *tert*-ブトキシを表す。

【0115】

R^2 および R^3 は互いに独立して各々が特に大変好ましくは水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシまたは *tert*-ブトキシを表す。

40

【0116】

R^4 は特に大変好ましくは塩素、臭素、または以下の基の1つ

(1) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

を表す。

【0117】

R^5 は特に大変好ましくはフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル、メチル、エチル、メトキ

50

シ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{OSO}_2\text{NMe}_2$ または $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ を表す。

【0118】

R^5 は特に大変好ましくは水素を表す。

【0119】

Xは特に大変好ましくは直接結合、酸素、硫黄、 $-\text{SO}_2-$ 、カルボニル、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ (EまたはZ)、 $-\text{C}\equiv\text{C}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-(\text{CH}_2)_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ または $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{O}-$ を表す。

10

【0120】

Aは特に大変好ましくは場合により W^1 のリストからの基でモノーもしくはジ置換されていてもよいフェニルを表すか、あるいは各々が場合により W^2 のリストからの基でモノーもしくはジ置換されていてもよいテトラゾリル、フリル、ベンゾフリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピロリル、インドリル、オキサゾリル、ベンズオキサゾリル、イソキサジル、イミダジル、ピラジル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジル、トリアジニルまたはトリアジルを表す。

【0121】

Bは特に大変好ましくは場合により W^1 のリストからの基でモノ置換されていてもよいp-フェニレンを表す。

20

【0122】

Zは特に大変好ましくは酸素、硫黄または $-\text{SO}_2-$ を表す。

【0123】

Dは特に大変好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、2-プロペニル、ブテニル、プロパルギル、ブチニル、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CClF}_2$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHF CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHF CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ または $-\text{SO}_2\text{NMe}_2$ を表す。

【0124】

Yは特に大変好ましくは直接結合、酸素、硫黄、 $-\text{SO}_2-$ 、カルボニル、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ (EまたはZ)、 $-\text{C}\equiv\text{C}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-(\text{CH}_2)_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ または $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{O}-$ を表す。

30

【0125】

Eは特に大変好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、2-プロペニル、ブテニル、プロパルギル、ブチニル、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CClF}_2$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHF CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHF CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{SO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ または $-\text{SO}_2\text{NMe}_2$ を表す。

40

【0126】

W^1 は特に大変好ましくはシアノ、フッ素、塩素、臭素、ホルミル、ニトロ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CClF}_2$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHF CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CHF CF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{SCHF}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SOCHF}_2$ 、 $-\text{SOCF}_3$ 、 $-\text{SO}$

50

$_2\text{NMe}_2$ 、 $-\text{OSO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 、 $-\text{COCH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $-\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{NMe}$ 、 $-\text{C}(\text{Me})=\text{N}-\text{O}(\text{Et})$ または $-\text{C}(\text{Et})=\text{N}-\text{OMe}$ を表す。

【0127】

W^2 は特に大変好ましくはシアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{COCH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NMe}_2$ 、 $-\text{OSO}_2\text{NMe}_2$ 、 $-\text{C}(\text{Me})=\text{N}-\text{O}(\text{Et})$ または $-\text{C}(\text{Et})=\text{N}-\text{OMe}$ を表す。

【0128】

Qは特に大変好ましくは $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2$ - n -プロピル、 $-\text{CO}_2$ -イソプロピル、 $-\text{CO}_2$ - n -ブチル、 $-\text{CO}_2$ -イソブチル、 $-\text{CO}_2$ -sec-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -tert-ブチル、 $-\text{CO}_2$ - n -ペンチル、 $-\text{CO}_2$ -ネオペンチル、 $-\text{CO}_2$ -sec-イソアミル、 $-\text{CO}_2$ -ペンタン-3-イル、 $-\text{CO}_2$ -シクロペンチル、 $-\text{CO}_2$ - n -ヘキシル、 $-\text{CO}_2$ -シクロヘキシル、 $-\text{CO}_2$ -トリフルオロエチル、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $-\text{CO}_2\text{Ph}$ 、 $-\text{COCH}_3$ 、 $-\text{COCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}-n$ -プロピル、 $-\text{CONHMe}$ 、 $-\text{CONHEt}$ 、 $-\text{CONH}(n$ -プロピル)、 $-\text{CONH}(\text{イソプロピル})$ 、 $-\text{CONH}(n$ -ブチル)、 $-\text{CONH}(\text{tert-ブチル})$ 、 $-\text{CONH}(n$ -ペンチル)、 $-\text{CONH}(n$ -ヘキシル)、 $-\text{CONH}(\text{シクロヘキシル})$ 、 $-\text{CONMe}_2$ 、 $-\text{CONEt}_2$ 、 $-\text{CON}(n$ -プロピル) $_2$ 、 $-\text{CON}(\text{イソプロピル})_2$ 、 $-\text{CON}(n$ -ブチル) $_2$ 、 $-\text{CON}(n$ -ペンチル) $_2$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})\text{Et}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})n$ -プロピル、 $-\text{CON}(\text{Me})n$ -ブチル、 $-\text{CON}(\text{Me})n$ -ペンチル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{PO}(\text{OMe})_2$ 、ピロリジノカルボニル、ペリジノカルボニル、 $-\text{PO}(\text{OEt})_2$ 、 $-\text{PO}(\text{OPh})_2$ 、ジヒドロジオキサジニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリルまたはテトラゾリルを表す。

【0129】

Qはさらに特に大変好ましくは $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NO}_2$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、2-メトキシカルボニル-プロピルオキシカルボニル、3-(2-オキソ-1-ピロリジニル)プロピルオキシカルボニル、 N -4-フルオロフェニル- N -イソプロピル-アミノ-2-オキソ-エチルオキシカルボニル、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-\text{Ph}$ 、2-クロロベンジルオキシカルボニル、3-クロロベンジルオキシカルボニル、4-クロロベンジルオキシカルボニル、1-フェニルエチルオキシカルボニル、3-フェニルプロピルオキシカルボニル、2-フェノキシエチルオキシカルボニル、4-メチルシクロヘキシルオキシカルボニル、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル、1-シクロヘキシルエチルオキシカルボニル、3-フルフリルオキシカルボニル、2-テニルオキシカルボニル、3-テニルオキシカルボニル、2-ピリジニルメチルオキシカルボニル、3-ピリジニルメチルオキシカルボニル、6-クロロ-3-ピリジニルメチルオキシカルボニル、1-テトラヒドロナフチルオキシカルボニル、1-インダニルオキシカルボニル、 $-\text{CON}(\text{H})\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、メトキシエチルアミノカルボニル、4-トリフルオロメトキシフェニル-アミノカルボニル、ベンジル-アミノカルボニル、2-クロロベンジル-アミノカルボニル、3-クロロベンジル-アミノカルボニル、4-クロロベンジル-アミノカルボニル、3-メチルベンジル-アミノカルボニル、4-メチルベンジル-アミノカルボニル、2,4-ジクロロベンジル-アミノカルボニル、2-メトキシベンジル-アミノカルボニル、2,3-ジメトキシベンジル-アミノカルボニル、3,5-ジメチルベンジル-アミノカルボニル、2,4-ジフルオロベンジル-アミノカルボニル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル-アミノカルボニル、シクロヘキシルメチル-アミノカルボニル、2-テニル-アミノカルボニル、2-テトラヒドロフリルメチル-アミノカルボニル、2-チアゾリル-アミ

10

20

30

40

50

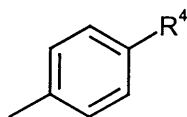
ノカルボニル、5-メトキシカルボニル-2-チアゾリル-アミノカルボニルまたはモルホリノカルボニルを表す。

【0130】

Ar² は大変特別に好ましくは基

【0131】

【化46】



10

【0132】

を表す。

【0133】

R¹ は大変特別に好ましくはフッ素または塩素を表す。

【0134】

R² は大変特別に好ましくは水素、塩素またはフッ素を表す。

【0135】

R⁴ は大変特別に好ましくはB-Z-Dを表す。

【0136】

Bは大変特別に好ましくはp-フェニレンを表す。

【0137】

Zは大変特別に好ましくは酸素または硫黄を表す。

【0138】

Dは大変特別に好ましくは-CF₃を表す。

【0139】

Qは大変特別に好ましくは-CO₂CH₃、-CO₂CH₂CH₃、-CO₂-n-プロピル、-CO₂-イソプロピル、-CO₂-n-ブチル、-CO₂-イソブチル、-CO₂-sec-ブチル、-CO₂-tert-ブチル、-CO₂-n-ペンチル、-CO₂-ネオペンチル、-CO₂-sec-イソアミル、-CO₂-ペンタン-3-イル、-CO₂-シクロペンチル、-CO₂-n-ヘキシル、-CO₂-シクロヘキシル、-CONHMe、-CONHEt、-CONH(n-プロピル)、-CONH(イソプロピル)、-CONH(n-ブチル)、-CONH(tert-ブチル)、-CONH(n-ペンチル)、-CONH(n-ヘキシル)、-CONH(シクロヘキシル)、-CONMe₂、-CONEt₂、-CON(n-プロピル)₂、-CON(イソプロピル)₂、-CON(n-ブチル)₂、-CON(n-ペンチル)₂、-CON(Me)Et、-CON(Me)n-プロピル、-CON(Me)n-ブチル、-CON(Me)n-ペンチル、-CN、ピロリジノカルボニルまたはピペリジノカルボニルを表す。

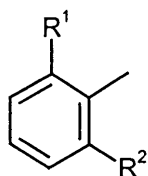
30

【0140】

Ar¹ は最も好ましくは基

【0141】

【化47】



【0142】

を表す。

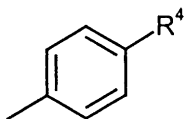
50

【0143】

Ar² は最も好ましくは基

【0144】

【化48】



【0145】

を表す。

10

【0146】

R¹ は最も好ましくはフッ素または塩素を表す。

【0147】

R² は最も好ましくは水素、塩素またはフッ素を表す。

【0148】

R⁴ は最も好ましくはB-Z-Dを表す。

【0149】

Bは最も好ましくはp-フェニレンを表す。

【0150】

Zは最も好ましくは酸素または硫黄を表す。

20

【0151】

Dは最も好ましくは-CF₃を表す。

【0152】

Qは最も好ましくは-CO₂CH₃、-CO₂CH₂CH₃、-CO₂-n-プロピル、
 -CO₂-イソプロピル、-CO₂-n-ブチル、-CO₂-イソブチル、-CO₂-s
 ec-ブチル、-CO₂-tert-ブチル、-CO₂-n-ペンチル、-CO₂-ネオ
 ペンチル、-CO₂-sec-イソアミル、-CO₂-ペンタン-3-イル、-CO₂-
 シクロペンチル、-CO₂-n-ヘキシル、-CO₂-シクロヘキシル、-CONHMe
 、-CONHEt、-CONH(n-プロピル)、-CONH(イソプロピル)、-CO
 NH(n-ブチル)、-CONH(tert-ブチル)、-CONH(n-ペンチル)、
 -CONH(n-ヘキシル)、-CONH(シクロヘキシル)、-CONMe₂、-CO
 NEt₂、-CON(n-プロピル)₂、-CON(イソプロピル)₂、-CON(n-
 ブチル)₂、-CON(n-ペンチル)₂、-CON(Me)Et、-CON(Me)n
 -プロピル、-CON(Me)n-ブチル、-CON(Me)n-ペンチル、-CN、ピ
 ロリジノカルボニルまたはピペリジノカルボニルを表す。

30

【0153】

Qはさらに最も好ましくは-CO₂H、-CO₂CH₂CN、-CO₂(CH₂)₂CN
 、-CO₂(CH₂)₃CN、-CO₂CH₂C(CH₃)₂NO₂、-CO₂(CH₂
)₂OCH₃、2-メトキシカルボニル-プロピルオキシカルボニル、3-(2-オキソ
 -1-ピロリジニル)プロピルオキシカルボニル、N-4-フルオロフェニル-N-イソ
 プロピル-アミノ-2-オキソ-エチルオキシカルボニル、-CO₂(CH₂)₃CH=
 CH₂、-CO₂(CH₂)₂C(CH₃)=CH₂、-CO₂CH₂CH=CH-Ph
 、2-クロロベンジルオキシカルボニル、3-クロロベンジルオキシカルボニル、4-ク
 ロロベンジルオキシカルボニル、1-フェニルエチルオキシカルボニル、3-フェニルプ
 ロピルオキシカルボニル、2-フェノキシエチルオキシカルボニル、4-メチルシクロヘ
 キシルオキシカルボニル、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル、1-シクロヘキシル
 エチルオキシカルボニル、3-フルフリルオキシカルボニル、2-テニルオキシカルボニ
 ル、3-テニルオキシカルボニル、2-ピリジニルメチルオキシカルボニル、3-ピリジ
 ニルメチルオキシカルボニル、6-クロロ-3-ピリジニルメチルオキシカルボニル、1
 -テトラヒドロナフチルオキシカルボニル、1-インダニルオキシカルボニル、-CON

40

50

(H) CH_2CF_3 、メトキシエチルアミノカルボニル、4-トリフルオロメトキシフェニルアミノカルボニル、ベンジルアミノカルボニル、2-クロロベンジルアミノカルボニル、3-クロロベンジルアミノカルボニル、4-クロロベンジルアミノカルボニル、3-メチルベンジルアミノカルボニル、4-メチルベンジルアミノカルボニル、2,4-ジクロロベンジルアミノカルボニル、2-メトキシベンジルアミノカルボニル、2,3-ジメトキシベンジルアミノカルボニル、3,5-ジメチルベンジルアミノカルボニル、2,4-ジフルオロベンジルアミノカルボニル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシルアミノカルボニル、シクロヘキシルメチルアミノカルボニル、2-テニルアミノカルボニル、2-テトラヒドロフリルメチルアミノカルボニル、2-チアゾリルアミノカルボニル、5-メトキシカルボニル-2-チアゾリルアミノカルボニルまたはモルホリノカルボニルを表す。

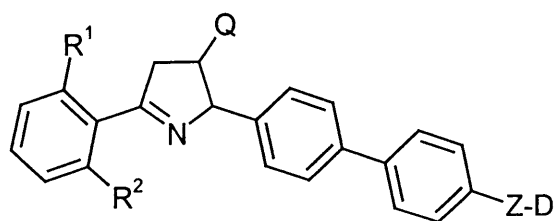
10

【0154】

特に好適であるのは、一般式 (I-c)

【0155】

【化49】



(I-c)

20

【0156】

式中、

R^1 、 R^2 、 Z 、 D および Q はそれぞれ上記定義の通りである、
の化合物である。

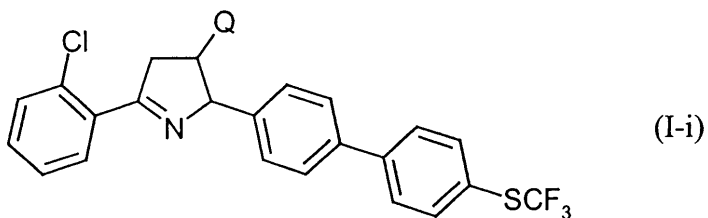
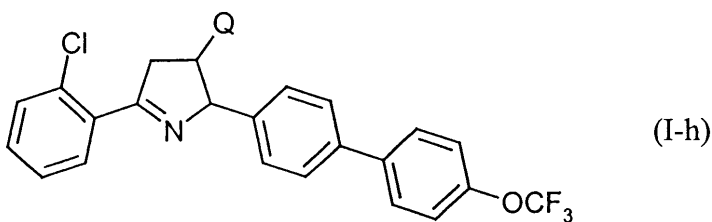
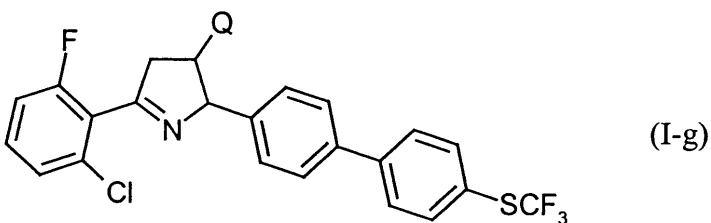
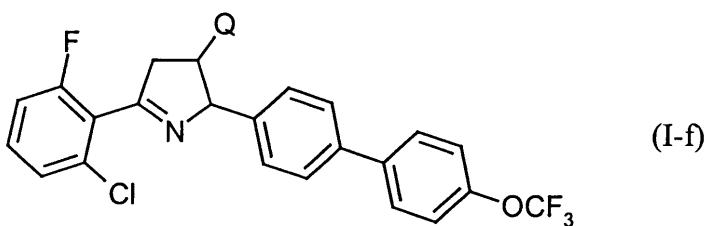
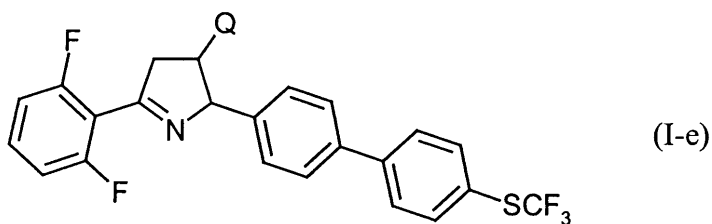
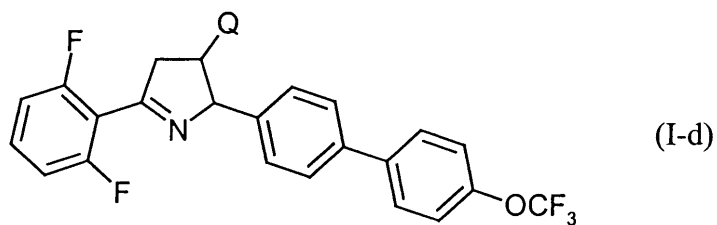
【0157】

特に好適であるのは、一般式 (I-d)、(I-e)、(I-f)、(I-g)、(I-h) および (I-i)

30

【0158】

【化50】



10

20

30

40

50

【0159】

式中、

Qは $-\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $-\text{CONHR}^8$ または $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ を表し、
ここで、 R^7 、 R^8 および R^9 はそれぞれ上記定義の通りである、
の化合物である。

【0160】

また特に好適であるのは、一般式(I-d)、(I-e)、(I-f)、(I-g)、(I-h)および(I-i)

式中、

Qは CO_2R^{13} または $-\text{CONR}^{14}\text{R}^{15}$ を表し、
ここで R^{13} 、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ上記定義の通りである、
の化合物である。

【0161】

また特に好適であるのは、一般式 (I-d)、(I-e)、(I-f)、(I-g)、(I-h) および (I-i)

式中、

Qは $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2$ -n-プロピル、 $-\text{CO}_2$ -イソ
プロピル、 $-\text{CO}_2$ -n-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -イソブチル、 $-\text{CO}_2$ -sec-ブチル、
10 $-\text{CO}_2$ -tert-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -n-ペンチル、 $-\text{CO}_2$ -ネオペンチル、 $-\text{CO}_2$ -sec-イソアミル、 $-\text{CO}_2$ -ペンタン-3-イル、 $-\text{CO}_2$ -シクロペンチル
、 $-\text{CO}_2$ -n-ヘキシル、 $-\text{CO}_2$ -シクロヘキシル、 $-\text{CONHCH}_3$ 、 $-\text{CONHCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CONH}$ (n-プロピル)、 $-\text{CONH}$ (イソプロピル)、 $-\text{CONH}$
(n-ブチル)、 $-\text{CONH}$ (tert-ブチル)、 $-\text{CONH}$ (n-ペンチル)、 $-\text{CONH}$ (n-ヘキシル)、 $-\text{CONH}$ (シクロヘキシル)、 $-\text{CONMe}_2$ 、 $-\text{CONEt}_2$ 、 $-\text{CON}$ (n-プロピル) $_2$ 、 $-\text{CON}$ (イソプロピル) $_2$ 、 $-\text{CON}$ (n-ブチル) $_2$ 、 $-\text{CON}$ (n-ペンチル) $_2$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})\text{Et}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})$ n-プロ
20 プロピル、 $-\text{CON}(\text{Me})$ n-ブチル、 $-\text{CON}(\text{Me})$ n-ペンチル、ピロリジノカル
ボニルまたはピペリジノカルボニルを表す、
の化合物である。

【0162】

また特に好適であるのは、一般式 (I-d)、(I-e)、(I-f)、(I-g)、(I-h) および (I-i)

式中、

Qは $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NO}_2$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、2-メ
トキシカルボニル-プロピルオキシカルボニル、3-(2-オキソ-1-ピロリジニル)
30 プロピルオキシカルボニル、N-4-フルオロフェニル-N-イソプロピル-アミノ-2
-オキソ-エチルオキシカルボニル、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-\text{Ph}$ 、2-クロロベンジル
オキシカルボニル、3-クロロベンジルオキシカルボニル、4-クロロベンジルオキシカル
ボニル、1-フェニルエチルオキシカルボニル、3-フェニルプロピルオキシカルボニ
ル、2-フェノキシエチルオキシカルボニル、4-メチルシクロヘキシルオキシカルボニ
ル、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル、1-シクロヘキシルエチルオキシカルボニ
ル、3-フルフリルオキシカルボニル、2-テニルオキシカルボニル、3-テニルオキシ
カルボニル、2-ピリジニルメチルオキシカルボニル、3-ピリジニルメチルオキシカル
ボニル、6-クロロ-3-ピリジニルメチルオキシカルボニル、1-テトラヒドロナフチ
ルオキシカルボニル、1-インダニルオキシカルボニル、 $-\text{CON}(\text{H})\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、
40 メトキシエチルアミノカルボニル、4-トリフルオロメトキシフェニル-アミノカルボニ
ル、ベンジル-アミノカルボニル、2-クロロベンジル-アミノカルボニル、3-クロロ
ベンジル-アミノカルボニル、4-クロロベンジル-アミノカルボニル、3-メチルベン
ジル-アミノカルボニル、4-メチルベンジル-アミノカルボニル、2,4-ジクロロベ
ンジル-アミノカルボニル、2-メトキシベンジル-アミノカルボニル、2,3-ジメト
キシベンジル-アミノカルボニル、3,5-ジメチルベンジル-アミノカルボニル、2,
4-ジフルオロベンジル-アミノカルボニル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル-
アミノカルボニル、シクロヘキシルメチル-アミノカルボニル、2-テニル-アミノカル
ボニル、2-テトラヒドロフリルメチル-アミノカルボニル、2-チアゾリル-アミノカ
ルボニル、5-メトキシカルボニル-2-チアゾリル-アミノカルボニルを表すか、また
はモルホリノカルボニルを表す、

10

20

30

40

50

化合物である。

【0163】

さらに好適な群は、式 (I)

式中、Qが $-\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $-\text{COR}^{10}$ 、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CSNH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{PO}(\text{OR}^{11})_2$ 、または窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2～4個のヘテロ原子を有する5～7員の飽和もしくは不飽和複素環を表し、そして Ar^1 、 Ar^2 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{11} が各々上記に与えた一般的意味を有する、
の化合物である。

【0164】

さらに好適な群は、式 (I)

式中、Qが $-\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $-\text{COR}^{10}$ 、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CSNH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{PO}(\text{OR}^{11})_2$ 、または窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2～4個のヘテロ原子を有する5～7員の飽和もしくは不飽和複素環を表し、そして Ar^1 、 Ar^2 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{11} が各々上記に与えた好適な意味を有する、
の化合物である。

【0165】

さらに好適な群は、式 (I)

式中、Qが $-\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $-\text{COR}^{10}$ 、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{PO}(\text{OR}^{11})_2$ 、または窒素、酸素および硫黄よりなる群からの2～4個のヘテロ原子を有する5～7員の飽和もしくは不飽和複素環（特にジヒドロジオキサジン、オキサゾリン、チアゾリン、イミダゾリン、テトラゾール）を表し、そして Ar^1 、 Ar^2 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{11} は各々上記に与えた特に好適な意味を有する、
の化合物である。

【0166】

さらに好適な群は、式 (I)

式中、Qが $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}_2$ -n-プロピル、 $-\text{CO}_2$ -イソプロピル、 $-\text{CO}_2$ -n-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -イソブチル、 $-\text{CO}_2$ -sec-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -tert-ブチル、 $-\text{CO}_2$ -n-ペンチル、 $-\text{CO}_2$ -ネオペンチル、 $-\text{CO}_2$ -sec-イソアミル、 $-\text{CO}_2$ -ペンタン-3-イル、 $-\text{CO}_2$ -シクロペンチル、 $-\text{CO}_2$ -n-ヘキシル、 $-\text{CO}_2$ -シクロヘキシル、 $-\text{CO}_2$ -トリフルオロエチル、 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $-\text{CO}_2\text{Ph}$ 、 $-\text{COCH}_3$ 、 $-\text{COCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CO}$ -n-プロピル、 $-\text{CONHMe}$ 、 $-\text{CONHEt}$ 、 $-\text{CONH}(\text{n-プロピル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{イソプロピル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{n-ブチル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{tert-ブチル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{n-ペンチル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{n-ヘキシル})$ 、 $-\text{CONH}(\text{シクロヘキシル})$ 、 $-\text{CONMe}_2$ 、 $-\text{CONEt}_2$ 、 $-\text{CON}(\text{n-プロピル})_2$ 、 $-\text{CON}(\text{イソプロピル})_2$ 、 $-\text{CON}(\text{n-ブチル})_2$ 、 $-\text{CON}(\text{n-ペンチル})_2$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})\text{Et}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})\text{n-プロピル}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})\text{n-ブチル}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})\text{n-ペンチル}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{PO}(\text{OMe})_2$ 、ピロリジノカルボニル、ピペリジノカルボニル、 $-\text{PO}(\text{OEt})_2$ 、 $-\text{PO}(\text{OPh})_2$ 、ジヒドロジオキサジニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリルまたはテトラゾリルを表し、そして Ar^1 、 Ar^2 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{11} が各々上記に与えた特に大變好適な意味を有する、
の化合物である。

【0167】

一般式 (I) は、*により示される2つの不斉中心を有する。

【0168】

10

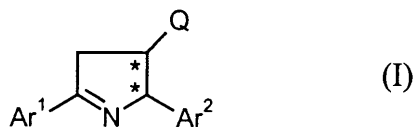
20

30

40

50

【化 5 1】



【0 1 6 9】

好適であるのは、2つのキラル中心上の置換基 Q および Ar^2 がシス位である一般式 (I) の化合物である。

【0 1 7 0】

上に述べた定義において、オキシアルキレンおよびチオアルキレンはそれぞれ、 $-O-$ アルキルおよび $-S-$ アルキルを表し、ここで基は酸素または硫黄原子を介して例えば Ar^2 に結合し、そして例えば $-X-A$ 中の A のようなさらなる置換基は、適当な場合はアルキル基で結合している。アルキレンオキシおよびアルキレンチオはそれぞれ、 $-O-$ アルキルおよび $-S-$ アルキルを表し、ここで基は各々の場合でアルキル基を介して例えば Ar^2 に結合し、そして適当ならば例えば $-X-A$ 中の A のようなさらなる置換基は、酸素または硫黄原子で結合する。オキシアルキレンオキシは、 $-O-O-$ アルキルを表す。

10

【0 1 7 1】

本記載では、ヘテロシクリルは飽和もしくは不飽和の環式炭化水素を表し、ここで 1 以上の炭素原子が 1 以上のヘテロ原子により置き換えられている。好適なヘテロ原子は、O、S、N および P、特に O、S および N である。

20

【0 1 7 2】

好適、特に好適および特に大変好適とは、それぞれ好ましい、特に好ましい、そして特に大変好ましいと述べた置換基を持つ化合物に対し与えられる。

【0 1 7 3】

アルキルまたはアルケニルのような飽和もしくは不飽和の炭化水素基は、可能な限り各々の場合で直鎖もしくは分枝であり、例えばアルコキシのようにヘテロ原子を含む組み合わせを含む。

【0 1 7 4】

場合により置換されていてもよい基はモノーまたはポリ置換されることができ、ここでポリ置換の場合、置換基は同一または異なることができる。例えば、m のような同じ指示を有する複数の基は、 $m > 1$ については基 R^5 は同一もしくは異なることができる。

30

【0 1 7 5】

例えば、ハロゲノアルキルのようなハロゲンにより置換された基は、モノーまたはポリ置換されている。ポリハロゲン化の場合、ハロゲン原子は同一もしくは異なってもよい。ハロゲンとはフッ素、塩素、臭素およびヨウ素を示し、特にフッ素、塩素および臭素を示す。

【0 1 7 6】

しかし、上記に与えた一般的または好適な基の定義または説明は、所望するように互いに、すなわち個々の範囲および好適な範囲間で組み合わせることができる。それらは最終生成物および対応して前駆体および中間体の両方に適用する。

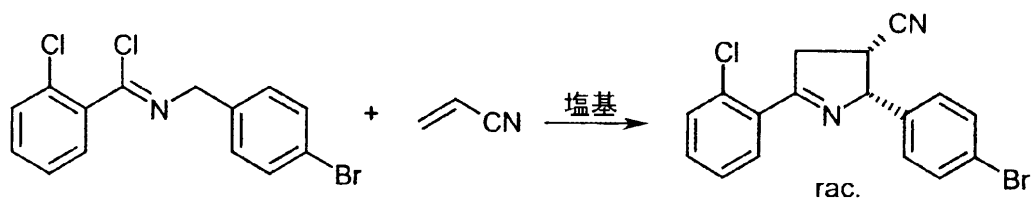
40

【0 1 7 7】

出発材料として $N-(4\text{-ブロモベンジル})-2\text{-クロロフェニルカルボキシミドイル}$ クロライドおよびアクリロニトリルを使用すると、本発明による方法 (A-1) の過程は以下の式により具体的に説明することができる。

【0 1 7 8】

【化 5 2】

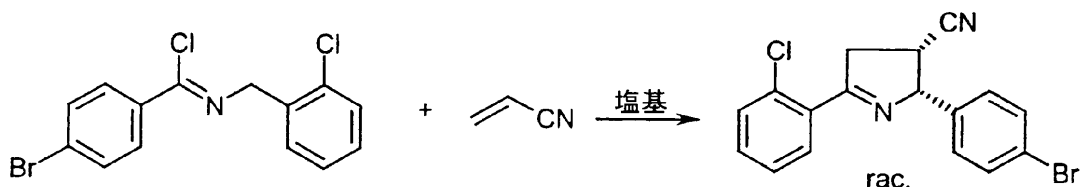


【0179】

出発材料としてN-(2-クロロベンジル)-4-ブロモフェニルカルボキシミドイルクロライドおよびアクリロニトリルを使用すると、本発明による方法(A-2)の過程は以下の式により具体的に説明することができる。

【0180】

【化53】

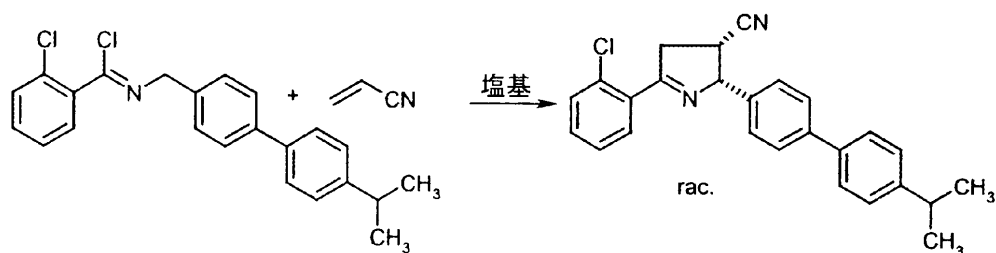


【0181】

出発材料として2-クロロ-N-[(4'-イソプロピル-1,1'-ビフェニル-4-イル)メチル]ベンゼンカルボキシミドイルクロライドおよびアクリロニトリルを使用すると、本発明による方法(A-1)の過程は以下の式により具体的に説明することができる。

【0182】

【化54】

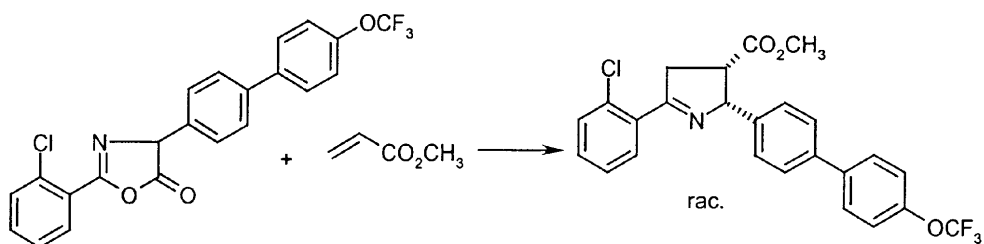


【0183】

出発材料として2-(2'-クロロベンジル)-4-[4'-(トリフルオロメトキシ)-1,1'-ビフェニル]オキサゾリジン-5-オンおよびメチルアクリレートを使用すると、本発明による方法(B)の過程は以下の式により具体的に説明することができる。

【0184】

【化55】



【0185】

出発材料としてN-(2-クロロベンジル)-2-[(4'-トリフルオロメトキシ)ビ

10

20

30

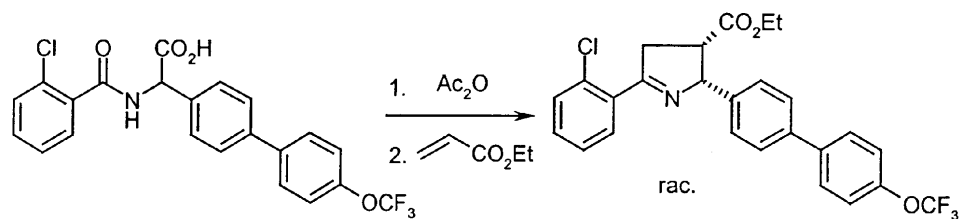
40

50

フェニル] グリシンおよび無水酢酸を使用すると、本発明による方法 (C) の過程は以下の式により具体的に説明することができる。

【0186】

【化56】



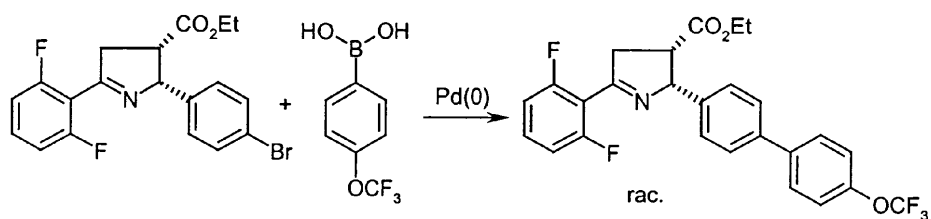
10

【0187】

出発材料としてエチル 2-((4-ブロモフェニル)-5-((2,6-ジフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボキシレートおよび 4-トリフルオロメトキシフェニル-ボロン酸を使用すると、本発明による方法 (D) の過程は以下の式により具体的に説明することができる。

【0188】

【化57】



20

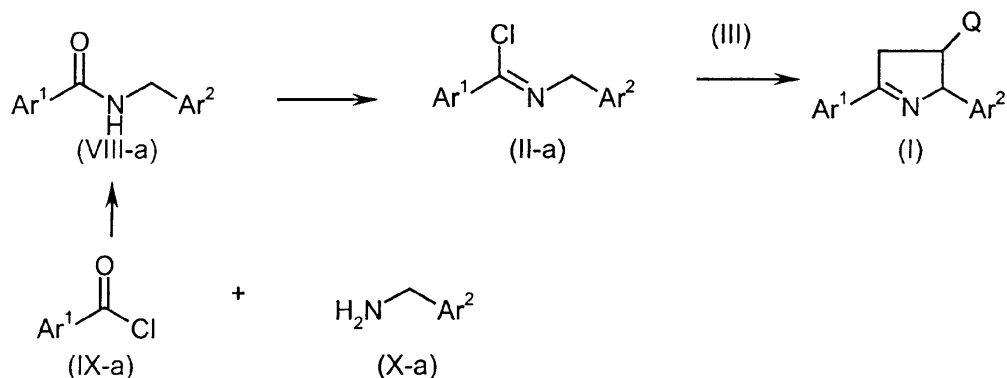
【0189】

方法および中間体の具体的説明：

方法 (A-1)

【0190】

【化58】



30

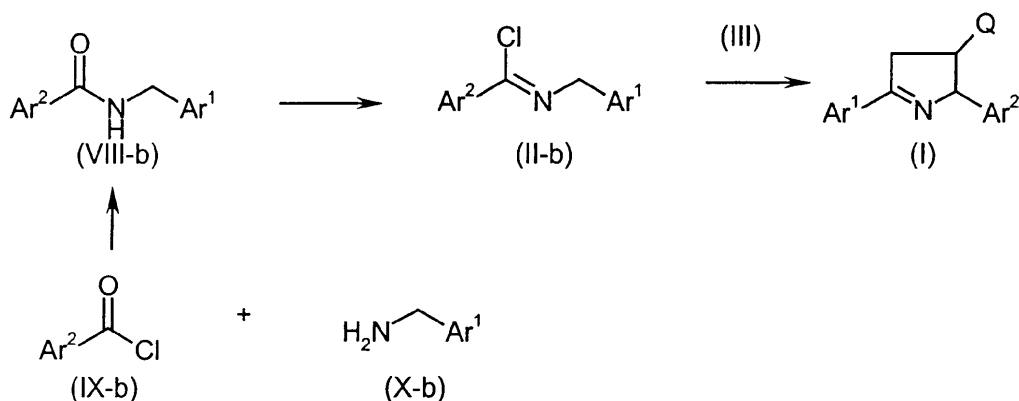
40

【0191】

方法 (A-2)

【0192】

【化59】



10

【0193】

式 (I I - a) および (I I - b) は、本発明に従い方法 (A - 1) および (A - 2) を行うための出発材料として必要なイミノクロライドの一般的定義を提供する。これらの式において、 Ar^1 および Ar^2 は好ましくは、特に好ましくは等で、本発明による式 (I) の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。

【0194】

本発明に従い方法 (A - 1) および (A - 2) を行うための出発材料として必要な式 (I I - a) および (I I - b) のイミノクロライドは、式 (V I I I - a) および (V I I I - b) のアミドを塩化剤 (例えば SOCl_2) と、希釈剤の存在下で反応させることにより製造することができる。(さらに反応に関しては、Pataiの「炭素-窒素二重結合の化学 (The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond)」、インターサイエンス (Interscience)、ニューヨーク、1970、第597-662頁を参照にされたい)。

20

【0195】

式 (V I I I - a) および (V I I I - b) は、本発明に従い方法 (A - 1) および (A - 2) を行うための出発材料として必要なアミドの一般的定義を提供する。これらの式において、 Ar^1 および Ar^2 は好ましくは、特に好ましくは等で、本発明による式 (I) の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。

30

【0196】

式 (V I I I - a) および (V I I I - b) アミドは、例えば式 (I X - a) および (I X - b) の酸クロライドを、式 (X - a) および式 (X - b) のベンジルアミンと、塩基 (例えば Et_3N または NaOH) の存在下で、そして希釈剤の存在下で反応させることにより製造することができる。

【0197】

式 (I X - a) および (I X - b) ならびに式 (X - a) および (X - b) は、本発明に従い方法 (A - 1) および (A - 2) を行うための出発材料として必要なそれぞれ酸クロライドおよびベンジルアミンの一般的定義を提供する。これらの式において、 Ar^1 および Ar^2 は好ましくは、特に好ましくは、そして特に大変好ましくは、本発明による式 (I) の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。

40

【0198】

式 (I X - a) および (I X - b) の酸クロライドは一般に既知である。式 (X - a) および (X - b) のベンジルアミンの幾つかは既知である；しかしそれらは対応するニトリルまたはアルデヒドから、既知の方法 (還元または還元的アミノ化) (例えば、Vogelの実践的有機化学の教科書 (Vogel's Textbook Of Practical Organic Chemistry)、第5版、1989、ジョン ウィリー アン

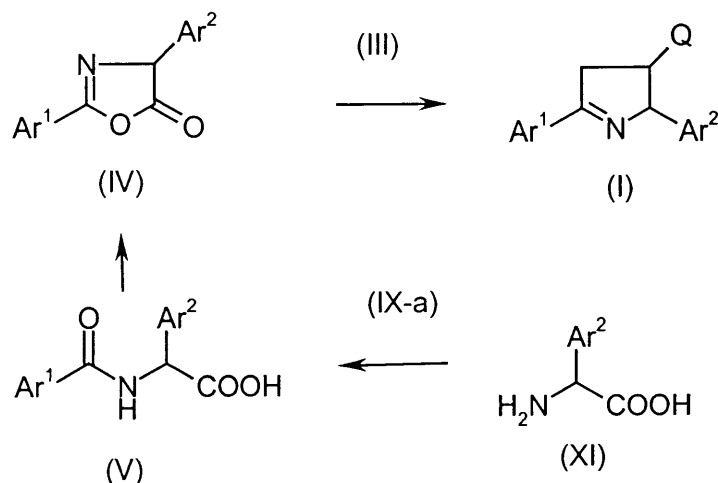
50

ドサンズ (John Wiley and Sons)、ニューヨーク、著者：Vogel、Arthur、イスラエル；Furniss, Hannaford, Smith and Tatcheilにより改定、ISBN 0-582-46236-3を参照にされたい)により製造することができる。

方法 (B)

【0199】

【化60】



10

20

【0200】

式 (I V) は、本発明に従い方法 (B) を行うための出発材料として必要なオキサゾリジノンの一般的定義を提供する。これらの式において、Ar¹ および Ar² は好ましくは、特に好ましくは等で、本発明による式 (I) の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。

【0201】

本発明に従い方法 (B) を行うための出発材料として必要な式 (I V) のオキサゾリジノンは、式 (V) の N-ベンゾイル-α-アミノ酸から、技術文献により既知の実施例に準じて製造することができる。次いで式 (I V) のオキサゾリジノンは、式 (I I I) のジポラロフィル化合物と反応させる (例えば、Chem. Ber. 1970, 103, 2368-2387 およびそこに引用されている技術文献を参照にされたい)。

30

【0202】

式 (V) は、本発明に従い方法 (B) を行うための出発材料として必要な N-ベンゾイル-α-アミノ酸の一般的定義を提供する。これらの式において、Ar¹ および Ar² は好ましくは、特に好ましくは等で、本発明による式 (I) の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。

【0203】

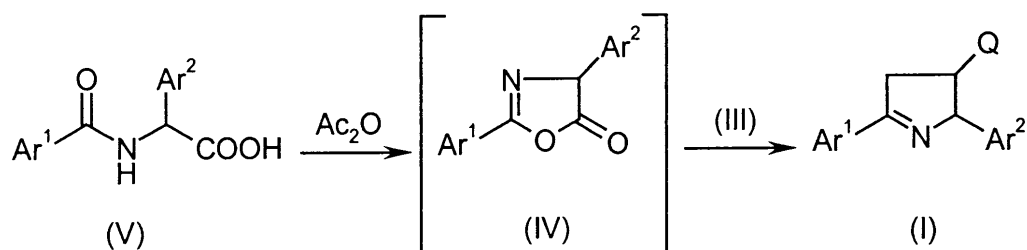
式 (V) の化合物は、式 (X I) のアミノ酸誘導体から、塩基および希釈剤の存在下で式 (I X-a) の酸クロライドとの反応により得ることができる。式 (X I) のアミノ酸の幾つかは市販されており、かつ／またはそれらは既知の方法により製造することができる (例えば Tetrahedron 1994, 50, 1539-1650 およびそこに引用されている技術文献を参照にされたい)。

40

方法 (C)

【0204】

【化61】



【 0 2 0 5 】

本発明に従い式（Ⅰ）の化合物を製造するために、式（Ⅴ）のN-ベンゾイル-α-アミノ酸を直列（t a n d e m）反応で反応させることも可能である。このために、式（ⅠⅤ）のオキサゾリジノンを経由して式（Ⅴ）の化合物および無水酢酸から i n s i t u で製造し（例えばChem. Ber. 1970, 103, 2368-2387を参照にされたい）、そして次いで方法（B）に従い式（ⅠⅠⅠ）のジポラロフィル化合物と反応させる。

【 0 2 0 6 】

式 (I I I) は、本発明に従い方法 (A-1)、(A-2)、(B) および (C) を行うための出発材料として必要なジポラロフィル化合物の一般的定義を提供する。これらの式において、Qは好ましくは、特に好ましくは等で、本発明による式 (I) の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。

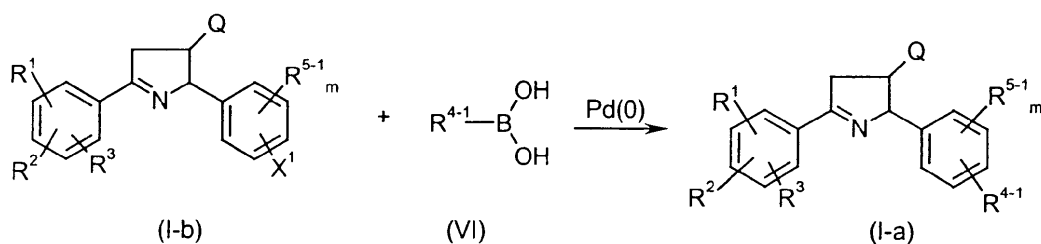
【 0 2 0 7 】

式 (I I I) の化合物 (Q = エステル、ニトリル、ケトン、アミド、リン酸エステル、スルホン) は一般的に既知であり、かつ／または市販されている。

方法 (D)

【 0 2 0 8 】

【化 6 2】



【 0 2 0 9 】

本発明による式（Ⅰ）の活性化合物中の Ar^2 が、場合により置換されたビフェニルを表す場合、式（Ⅰ-a）の化合物は式（Ⅰ-b）の化合物を式（ⅤⅠ）のボロン酸と、パラジウム触媒の存在下で、そして塩基の存在下で、そして希釈剤の存在下でカップリングすることにより製造することが可能である。

【 0 2 1 0 】

式（I-a）および（I-b）の化合物において、 R^1 、 R^2 、 R^3 および m は各々が好ましくは、特に好ましくは等で、本発明による式（I）の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。

【 0 2 1 1 】

R⁵⁻¹ は好ましくはフッ素、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロゲノアルキル、C₁-C₆-ハロゲノアルコキシ、トリ(C₁-C₆-アルキル)-シリル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、-CONR⁷R⁸、-OSO₂NR⁷R⁸、-S(O)₀R⁶、-NR⁷R⁸、-NHCO₂R⁶または(C₁-C₆-ハロゲノアルキル)アミノスルホニルを表す。

【 0 2 1 2 】

R^{5-1} は特に好ましくはフッ素、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、各々の場合にフッ素—または塩素—により置換された C_1-C_6 -アルキルまたは C_1-C_6 -アルコキシ、 $-CONR^7R^8$ 、 $-OSO_2NR^7R^8$ 、 $-S(O)_OR^6$ 、 $-NR^7R^8$ または $-NHCO_2R^6$ を表す。

【0213】

R^{5-1} は特に大変好ましくはフッ素、ヒドロキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、 $-OSO_2NMe_2$ または $-SO_2CF_3$ を表す。

【0214】

式 (I-b) の化合物において、 X^1 は好ましくは塩素、臭素またはヨウ素、特に好ましくは塩素または臭素、特に大変好ましくは臭素を表す。 10

【0215】

式 (I-a) および (VI) の化合物において、 R^{4-1} は A または $-B-Z-D$ を表す。ここで A、B、Z および D は各々が好ましくは、特に好ましく等で、本発明による式 (I) の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。

【0216】

式 (I-b) の化合物は、方法 A、B または C により製造される。式 (VI) のボロン酸の幾つかは既知である；しかしそれらは (ブromo) 芳香族からリチオ化または $Br-Li$ (Mg) 交換、そして続いてトリスアルコキシボロン化合物との反応により製造することができる (例えば、Tetrahedron Lett. 1993, 34, 8237-8240 を参照にされたい)。 20

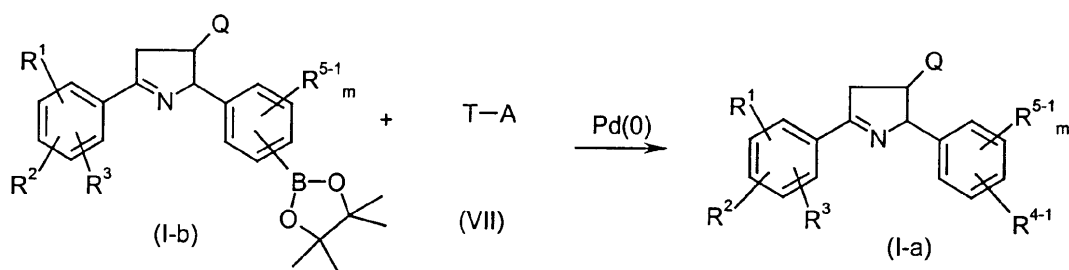
【0217】

式 (I-a) の化合物はさらに、式 (I-b) の化合物 [$X^1 = 2-(4,4,5,5$ -テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン] および式 (VII) の (ヘテロ) サイクルから、技術文献で既知の方法に準じて製造することができる (J. Org. Chem. 1995, 60, 7058; Tetrahedron Lett. 1997, 38, 3841 を参照にされたい)。

【0218】

【化63】

30



【0219】

式 (VII) の (ヘテロ) サイクルにおいて、T は好ましくは塩素、臭素またはヨウ素、特に好ましくは塩素または臭素、特に大変好ましくは塩素を表す。A は好ましくは、特に好ましく等で、本発明による式 (I) の化合物の記載との関連でこれらの基に関して好適、特に好適等としてすでに述べた意味を有する。式 (VII) の化合物は既知であるか、または既知の方法により製造することができる。 40

【0220】

本発明に従い方法 (D) を行うために、一般にパラジウム触媒を使用し、その一部にさらなるリガンドを加えるか、または加えなくてもよい。使用する触媒は、好ましくは $PdCl_2(dppf)$ [$dppf = 1,1'$ -ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン]、 $Pd(PPh_3)_4$ 、 $PdCl_2(PPh_3)_2$ 、 $PdCl_2(CH_3CN)_2$ 、 Pd_2 50

(dba)₃ [dba = ジベンジリデンアセトン] または Pd(OAc)₂、特に好ましくは PdCl₂(dppf)、Pd(PPh₃)₄、PdCl₂(PPh₃)₂ または Pd(OAc)₂、特に大変好ましくは PdCl₂(dppf) または Pd(PPh₃)₄ である。適当なリガンドは、トリアリールホスフィン、トリアルキルホスフィンまたはアルシンである。好適であるのは、dppf、PPh₃、P(t-Bu)₃、Pcy₃ または AsPh₃、特に好ましくは dppf を使用することである。

【0221】

本発明に従い方法 (A-1)、(A-2)、(B)、(C) および (D) を行う時、式 (I) または (I-a) の化合物 (式中、Q は -CO₂H を表す) は、例えば既知の方法に従い対応するメチルエステルを加水分解することにより得られる (T. W. Greene P. G. M. Wuts, 「有機合成における保護基 (Protective Group in Organic Synthesis)」、第2版、第232-234頁を参照にされたい)。

【0222】

本発明に従い方法 (A-1)、(A-2)、(B)、(C) および (D) を行うために適当な酸結合剤は、各々の場合でそのような反応に通例のすべての無機および有機塩基である。好適であるのは、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウムのようなアルカリ土類金属またはアルカリ金属水酸化物、または水酸化アンモニウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウムのようなアルカリ金属炭酸塩、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウムのようなアルカリ金属またはアルカリ土類金属酢酸塩、およびまたトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N, N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン (DABCO)、ジアザビシクロノネン (DBN) またはジアザビシクロウンデセン (DBU) のような3級アミンを使用することである。しかしさらなる酸結合剤なしで作業するか、または酸結合剤として同時に作用するように過剰のアミン成分を使用することも可能である。

【0223】

本発明に従い方法 (A-1)、(A-2)、(B)、(C) および (D) を行うために適当な希釈剤は、各々の場合ですべての通例の不活性な有機溶媒である。好適であるのは、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンまたはトリクロロエタンのような場合によりハロゲン化された脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素：ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル t-ブチルエーテル、メチル t-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 2-ジエトキシエタンまたはアニソールのようなエーテル；アセトニトリル、プロピオニトリル、n-またはi-ブチロニトリルまたはベンゾニトリルのようなニトリル；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド；酢酸メチルまたは酢酸エチルのようなエステル；ジメチルスルフォキシドのようなスルフォキシド、またはスルホランのようなスルホンを使用することである。

【0224】

本発明に従い方法 (A-1)、(A-2)、(B)、(C) および (D) を行う時、反応温度は各々の場合で比較的広い範囲内で変動することができる。一般的に、この方法は 0℃ から 140℃ の間、好ましくは 10℃ から 120℃ の間の温度で行う。

【0225】

本発明に従い方法 (A-1)、(A-2)、(B)、(C) および (D) を行う時、反応は各々の場合で一般に大気圧下で行う。しかし各々の場合で加圧または減圧下で操作することも可能である。

【0226】

本発明に従い方法 (A-1) または (A-2) を行う時、1モルの式 (I I - a) または (I I - b) のイミノクロライドあたり、一般に2モルの式 (I I I) のジポラロフィル化合物および1~3モルの酸結合剤を使用する。しかし他の比率で反応成分を使用することも可能である。後処理は常法により行う。一般に反応混合物を抽出し、抽出物を洗浄し、そして乾燥させ、そして残渣は必要に応じてクロマトグラフィーまたは再結晶化のような常法を使用して未だ存在し得る不純物を除く。

【0227】

本発明に従い方法 (B) を行う時、1モルの式 (I V) のオキサゾリノンあたり、一般に2モルの式 (I I I) のジポラロフィル化合物を使用する。しかし他の比率で反応成分を使用することも可能である。後処理は常法により行う。一般に反応混合物を抽出し、抽出物を洗浄し、そして乾燥させ、そして残渣は必要に応じてクロマトグラフィーまたは再結晶化のような常法を使用して未だ存在し得る不純物を除く。

10

【0228】

本発明に従い方法 (C) を行う時、1モルの式 (V) のカルボン酸あたり、一般に2モルの式 (I I I) のジポラロフィル化合物および1~3モルの無水酢酸を使用する。しかし他の比率で反応成分を使用することも可能である。後処理は常法により行う。一般に反応混合物を抽出し、抽出物を洗浄し、そして乾燥させ、そして残渣は必要に応じてクロマトグラフィーまたは再結晶化のような常法を使用して未だ存在し得る不純物を除く。

【0229】

本発明に従い方法 (D) を行う時、1モルの式 (I) の化合物あたり、一般に1モルの式 (I I I) のジポラロフィル化合物またはそれらを過剰で、および1~5モルの酸結合剤および1/20モルの触媒を使用する。しかし他の比率で反応成分を使用することも可能である。後処理は常法により行う。一般に反応混合物を水とメチル tert -ブチルエーテルとの間に分配し、有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして残渣は必要に応じてクロマトグラフィーまたは再結晶化のような常法を使用して未だ存在し得る不純物を除く。

20

【0230】

本発明による活性化合物は、農業で、森林で、貯蔵産物および材料の保護で、および衛生区域で遭遇する動物有害生物、特に昆虫、蛛形類および線虫類を防除するために適し、そして良好な植物耐容および温血動物に対して好ましい毒性を有する。それらは好ましくは作物保護剤として使用され得る。それらは通常は感受性の、および耐性種に対して、そして発生のすべての、またはある段階で活性である。上記の有害生物には以下を含む：等脚類 (Isopoda) から、例えばオニスカス アセルス (Oniscus asellus)、アルマジリジウム ブルガレ (Armadillidium vulgare) およびポルセリオ スカバー (Porcellio scaber)。

30

【0231】

倍脚綱 (Diplopoda) から、例えばブラニウラス ギュタラタス (Blaniulus guttulatus)。

【0232】

唇脚綱 (Chilopoda) から、例えばゲオフィラス カルポファーガス (Geophilus carpophagus) およびスクチゲラ種 (Scutigera spp.)。

40

【0233】

結合綱 (Symphyla) から、例えばスクチゲレーラ イマクラータ (Scutigereella immaculata)。

【0234】

総尾目 (Thysanura) から、例えばレピスマ サッカリーナ (Lepisma saccharina)。

【0235】

粘管目 (Collembola) から、例えばオニキウラス アルマタス (Onychi

50

urus armatus)。

【0236】

直翅目 (Orthoptera) から、例えばアケータ ドメスティカス (Acheta domesticus)、グリロタルパ種 (Grylotalpa spp.)、ローカスタ ミグラトリア ミグラトリオイデス (Locusta migratoria migratorioides)、メラノプラス種 (Melanoplus spp.) およびシストセルカ グレガリア (Schistocerca gregaria)。

【0237】

網翅目 (Brattaria) から、例えばブラッタ オリエンタリス (Blatta orientalis)、ペリプラネータ アメリカーナ (Periplaneta americana)、ロウコファーエ マデラ (Leucophaea maderae) およびブラッテラ ゲルマニカ (Blatella germanica)。

【0238】

革翅目 (Dermaptera) から、例えばフォリフィクーラ オーリクラリア (Forficula auricularia)。

【0239】

等翅目 (Isoptera) から、例えばレティキュリターメス種 (Reticulitermes spp.)。

【0240】

フィチラプテラ (Phthiraptera) から、例えばペディキュラス ヒューマナス コルポリス (Pediculus humanus corporis)、ヘマトピナス種 (Haematopinus spp.)、リノグナタス種 (Linognathus spp.)、トリコデクタス種 (Tricodectes spp.) およびダマリニア種 (Damalinia spp.)。

【0241】

アザミウマ目 (Thysanoptera) から、例えばヘルシノタリプス フェモラリス (Hercinothrips femoralis)、トリプス タバシ (Thrips tabaci)、トリプス パルミ (Thrips palmi) およびフランクリニエーラ アクシデンタリス (Frankliniella accidentalis)。

【0242】

異翅目 (Heteroptera) から、例えばユーリガスター種 (Eurygaster spp.)、ディスデルカス インターメディウス (Dysdercus intermedius)、ピースマ クワドラータ (Piesma quadrata)、シメックス レクチュラリウス (Cimex lectularius)、ロードニウス プロリクウス (Rhodnius prolixus) およびトリアトーマ種 (Triatomas spp.)。

【0243】

同翅目 (Homoptera) から、例えばアロイロデス ブラッシカ (Aleyrodes brassicae)、ベミシア タバシ (Bemisia tabaci)、トリアロイロデス バポーラリロラム (Trialeurodes vaporariorum)、アフイス ゴシッピイ (Aphis gossypii)、ブレビコリネ ブラッシカ (Brevicoryne brassicae)、クリプトミズス リビス (Cryptomyzus ribis)、アフイス ファーバエ (Aphis fabae)、アフイス ポミ (Aphis pomi)、エリオソーマ ラニゲラム (Eriosoma lanigerum)、ヒアロプテラス アルンディニス (Hyalopterus arundinis)、フィルロキセラ バスタトリックス (Phylloxera vastatrix)、ペムフィガス種 (Pemphigus spp.)、マクロシフィム アベナエ (Macrosiphum avenae)、ミズス種 (Myzus spp.)、フォロドン ヒュムリー (Phorodon humuli)、ロパロシフィウム パディ (Rhopalosiphum padi)、エムポアスカ種 (Empoasca spp.)、エウ

セリス バイロバタス (*Euscelis bilobatus*)、ネフォテトティクス シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、レカニウム コルニ (*Lecanium corni*)、サイセッティア オレア (*Saissetia oleae*)、ラオデルファックス ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*)、ニラパルバータ ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、アオニジーラ アウランティ (*Aonidiella aurantii*)、アスピジオタス ヘデラ (*Aspidiotus hederiae*)、シュードコッカス種 (*Pseudococcus* spp.) およびシーラ種 (*Psylla* spp.)。

【0244】

鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えばペクチノホーラ ゴシッピーラ (*Pectinophora gossypiella*)、ブパラス ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ケイマトビア ブルマータ (*Cheimatobia brumata*)、リソコルレティス ブランカルデーラ (*Lithocolletis blancardella*)、ヒポノメウタ パデーラ (*Hyponomeuta padella*)、プルテーラ キシロステーラ (*Plutella xylostella*)、マラコソーマ ノウストリア (*Malacosoma neustria*)、ユープロクティス クリソロップ (*Euproctis chrysorrhoea*)、リマントリア種 (*Lymantria* spp.)、ブククラトリックス サーベリエーラ (*Bucculatrix thurberiella*)、フィロッコニスティス シトレーラ (*Phyllocnistis citrella*)、アグロティス種 (*Agrotis* spp.)、ユークソア種 (*Euxoa* spp.)、フェルティア種 (*Feltia* spp.)、エアリアス インスラーナ (*Earias insulana*)、ヘリオディス種 (*Heliothis* spp.)、マメストラ ブラッシカ (*Mamestra brassica*)、パノリス フランメア (*Panolis flammea*)、スポドプテラ種 (*Spodoptera exigua*)、トリコプルシア ニー (*Trichoplusia ni*)、カルボカプサ ポモネーラ (*Carpocapsa pomonella*)、ピエリス種 (*Pieris* spp.)、キロ種 (*Chilo* spp.)、ピラウスタ ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、エフェスティア クエニエーラ (*Ephestia kuehniella*)、ガレリア メロネーラ (*Galleria mellonella*)、チネオラ ビッセリエーラ (*Tineola bisselliella*)、チネア ペリオネーラ (*Tinea pellionella*)、ホフマンノフィラ シュードスプレテーラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、カコエシア ポダナ (*Cacoecia podana*)、カプア レチクラーナ (*Capua reticulana*)、コリストネウラ フミフェラーナ (*Choristoneura fumiferana*)、クリシア アンビギュエーラ (*Clysia ambigella*)、ホモナ マグナニマ (*Homona magnanima*)、トルトリックス ビリダナ (*Tortrix viridana*)、シナファロセルス種 (*Cnaphalocerus* spp.)、オウレマ オリーゼ (*Oulema oryzae*)。

【0245】

甲虫目 (*Coleoptera*) の例として、例えばアノビウム パンクタタム (*Anobium punctatum*)、リゾペルサ ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、ブルキジウス オブテクタス (*Bruchidius obtectus*)、アカントセリデス オブテクタス (*Acanthoscelides obtectus*)、ヒロトゥルペス バジュラス (*Hylotrupes bajulus*)、アゲラスティカ アルニ (*Agelastica alni*)、レプチノタルサ デセムリネアータ (*Leptinotarsa decemlineata*)、フェドン コークレア (*Phaedon cochleariae*)、ディアブロティカ種 (*Diabrotica* spp.)、シリオデス クリソセファーラ (*Psylliodes chrysocephala*)、エピラキナ バリベスティス (*Epilachna varivestis*)

、アトマリア種 (*Atomaria* spp.)、オリーゼフィラス スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、アントノーマス種 (*Anthonomus* spp.)、シトフィラス種 (*Sitophilus* spp.)、オチオロリンカス スルカタス (*Otiorrhynchus sulcatus*)、コスモポリテス ソルディダス (*Cosmopolites sordidus*)、シュートリンカス アシッシンミリス (*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ヒペラ ポスティカ (*Hypera postica*)、ダーメステス種 (*Dermestes* spp.)、トロゴダーマ種 (*Trogoderma* spp.)、アントレナス種 (*Anthrenus* spp.)、アタッグナス種 (*Attagenus* spp.)、リクタス種 (*Lyctus* spp.)、メリゲセス アエネウス (*Meligethes aeneus*)、プチナス種 (*Ptinus* spp.)、ニプタス ホロローカス (*Niptus hololeucus*)、ギッビウム シロイデス (*Gibbium psylloides*)、トリボリウム種 (*Tribolium* spp.)、テネブリオ モリトール (*Tenebrio molitor*)、アグリオテス種 (*Agriotes* spp.)、コノデラス種 (*Conoderus* spp.)、メロロンサ メロロンサ (*Melolontha melolontha*)、アンフィマローン ソルスティティアリス (*Amphimallon solstitialis*)、コステリトラ ゼアランドイカ (*Costelytra zealandica*) およびリッソロプトラス オリゾフィラス (*Lissorhopterus oryzophilus*)。

10

20

30

40

50

【0246】

膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えばディプリオン種 (*Diprion* spp.)、ホプロカンパ種 (*Hoplocampa* spp.)、ラシウス種 (*Lasius* spp.)、モノモリウム ファラオニス (*Monomorium pharaonis*) およびベスパ種 (*Vespa* spp.)。

【0247】

双翅目 (*Diptera*) から、例えばアエデス種 (*Aedes* spp.)、アノフェラス種 (*Anopheles* spp.)、クレックス種 (*Culex* spp.)、ドロソフィリア メラノガスター (*Drosophila melanogaster*)、ムスカ種 (*Musca* spp.)、ファンニア種 (*Fannia* spp.)、カリフォーラ エリトロセファーラ (*Calliphora erythrocephala*)、ルシリア種 (*Lucilia* spp.)、クリソマイヤ種 (*Chrysomyia* spp.)、クテレブラ種 (*Cuterebra* spp.)、ガストロフィラス種 (*Gastrophilus* spp.)、ヒッポボスカ種 (*Hyppobosca* spp.)、ストモキシス種 (*Stomoxys* spp.)、オエストラス種 (*Oestrus* spp.)、ハイポダーマ種 (*Hypoderma* spp.)、タバナス種 (*Tabanus* spp.)、タンニア種 (*Tannia* spp.)、ビビオ ホルチュラナス (*Bibio hortulanus*)、オシネーラ フリット (*Oscinella frit*)、フォルビア種 (*Phorbia* spp.)、ペゴミア ヒオシアミ (*Pegomyia hyoscyami*)、セラティティス カピタータ (*Ceratitis capitata*)、ダカス オレア (*Dacus oleae*) およびチプューラ パルドーサ (*Tipula paludosa*)、ヒレミア種 (*Hylemyia* spp.) およびリリオミザ種 (*Liriomyza* spp.)。

【0248】

微翅目 (*Siphonaptera*) から、例えばキセノシーラ ケオピス (*Xenopsylla cheopis*) およびセラトフィラス種 (*Ceratophyllus* spp.)。

【0249】

蜘蛛亜綱 (*Arachnida*) から、例えばスコルピオ マウラス (*Scorpio maurus*)、ラトロデクタス マクタンズ (*Latrodectus mactans*)、アカラス シロ (*Acarus siro*)、アルガス種 (*Argas* spp.)、オ

ルニソドロス種 (*Ornithodoros* spp.)、ダーマニッサス ガリナ (*Dermanyssus gallinae*)、エリオフィエス リビス (*Eriophyes ribis*)、フィルロコプトルタ オレイボラ (*Phyllocopturta oleivora*)、ボーフィラス種 (*Boophilus* spp.)、リピセファラス種 (*Rhipicephalus* spp.)、アンブリオンマ種 (*Amblyomma* spp.)、ヒアロンマ種 (*Hyalomma* spp.)、イクソデス種 (*Ixodes* spp.)、ソロプテス種 (*Psoroptes* spp.)、コリオプテス種 (*Chorioptes* spp.)、サルコプテス種 (*Sarcoptes* spp.)、タルソネムス種 (*Tarsonemus* spp.)、ブリオビア プラエチオーサ (*Bryobia praetiosa*)、パノニカス種 (*Panonychus* spp.)、テトラニカス種 (*Tetranychus* spp.)、ヘミタルソネムス種 (*Hemitarsonemus* spp.)、ブレビパルパス種 (*Brevipalpus* spp.)

10

【0250】

植物寄生性の線虫には、例えばプラチレンカス種 (*Pratylenchus* spp.)、ラドフォーラス シミリス (*Radopholus similis*)、ジチレニカス ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、チレンクラス セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、ヘテロデラ種 (*Heterodera* spp.)、グロボデラ種 (*Globodera* spp.)、メロイドギネ種 (*Meloidogyne* spp.)、アフエレンコイデス種 (*Aphelenchoides* spp.)、ロンギドラス種 (*Longidorus* spp.)、キシフウネマ種 (*Xiphinema* spp.)、トリコドラス種 (*Trichodorus* spp.)、バーサフェレンカス種 (*Bursaphelenchus* spp.)を含む。

20

【0251】

本発明による式 (I) の化合物は、チョウ・ガの幼虫 (caterpillars)、甲虫の幼虫、アブラムシおよび葉にもぐるハエ (leaf-mining flies) に対して特に優れた活性を有する。

【0252】

本発明による式 (I) の化合物は、ハムシ (mustard beetle) (*Phaedon cochleariae*) の幼虫、シロヤナガ (*Spodoptera fugiperda*) の幼虫、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) の幼虫、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) およびすべての段階のナミハダニ (*Tetranychus urticae*) に対して特に優れた活性を有する。

30

【0253】

適当な場合、本発明の化合物を特定の濃度または施用率で使用することができなれば、殺虫剤または殺微生物剤、例えば殺菌・殺カビ剤、抗糸状菌剤および殺バクテリア剤として使用することもできる。適当ならばそれらは、さらなる活性化合物の合成のために中間体または前駆体として使用することもできる。

40

【0254】

植物全体および植物の一部を本発明に従い処理することができる。植物とは、本内容の意味として所望する、および所望しない野生植物または作物 (自然に発生する作物を含む) のような、すべての植物および植物群を意味すると考える。作物は通例の植物育種および至適化法により、またはバイオテクノロジー法および組換え法により、またはこれらの方法の組み合わせにより得られる植物であることができ、トランスジェニック植物を含み、そして植物の育種権者により保護され得る、または保護できない栽培変種を含む。植物部分とは、苗条、葉、花および根のような地上部および地下部の植物のすべての部分および器官を意味すると考え、挙げることができる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実、種子、根、塊茎および根茎である。植物部分には収穫した材料、および生長および生

50

産繁殖材料、例えば挿し木、球根、根茎、子球および種子も含む。

【0255】

本発明に従い活性化合物を用いて植物および植物部分を処理することは、直接的に、または例えば浸漬、噴霧、蒸発、煙霧、散布、塗布のような通例の処置法により化合物を植物の周囲、生育場所または貯蔵空間に作用させることにより、および生産材料の場合は特に種子の場合は1以上のコートを適用することにより行う。

【0256】

活性化合物は、溶剤、乳剤、水和剤、懸濁剤、パウダー、ダスト、ペースト、水溶性パウダー、粒剤、サスポエマルジョン製剤、活性化合物を含浸させた天然および合成材料、およびポリマー性物質のマイクロカプセル化のような通例の製剤に転換することができる。 10

【0257】

これらの製剤は、例えば活性化合物を増量剤、すなわち液体溶剤および／または固体キャリアーと混合し、場合によっては表面活性剤、すなわち乳化剤および／または分散助剤および／または発泡剤を使用することにより、周知の様式で調製する。

【0258】

使用する増量剤が水ならば、例えば有機溶媒は補助剤としても使用できる。特に適当な液体溶媒は：キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンのような芳香族、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンのような塩化芳香族および塩化脂肪族炭化水素、シクロヘキサンまたはパラフィンのような脂肪族炭化水素、例えば石油留分、鉱物および植物油、ブタノールまたはグリコールのようなアルコール、およびまたそれらのエーテルおよびエステル、アセトン、メチル エチル ケトン、メチル イソブチル ケトンまたはシクロヘキサノンのようなケトン、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルフォキシドのような強い極性溶媒、あるいはまた水である。 20

【0259】

固体キャリアーとして適当であるのは：

例えばアンモニウム塩およびカオリン、クレー、タルク、白亜、珪砂、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土のような挽いた天然鉱物、および高度に分散されたシリカ、アルミナおよび珪酸塩のような挽いた人工鉱物；粒剤に適当な固体キャリアーは：例えば方解石、大理石、軽石、海泡石および苦灰石のような粉碎し、そして分画した天然岩石、およびまた無機および有機粗挽き粉の合成顆粒、およびおが屑、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎のような有機材料の顆粒；があり、 30

乳化剤および／または発泡剤として適当であるのは：例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテルのような非イオン性およびアニオン性の乳化剤、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリアルスルホネートのような、あるいはタンパク質加水分解物；があり、

分散剤として適当であるのは：例えばリグニン－スルフィット廃液およびメチルセルロースがある。

【0260】

カルボキシメチルセルロース、およびアラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリビリアルアセテートのような粉末、顆粒または乳濁液状態の天然および合成ポリマー、ならびにセファリンおよびレシチンのような天然リン脂質、および合成リン脂質のような粘性付与剤も製剤に使用することができる。他の添加剤は、鉱物および植物油であることができる。 40

【0261】

例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプロシアンブルーのような無機顔料、ならびにアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料のような有機染料のような着色剤、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブテンおよび亜鉛の塩のような微量栄養素を使用することが可能である。

【0262】

製剤は一般的に、0.1から95重量%の間、好ましくは0.5から90%の間の活性化化合物を含んで成る。

【0263】

本発明の活性化化合物はそのまま、またはそれらの製剤で、殺虫剤、誘引剤、不妊剤、殺バクテリア剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌・殺カビ剤、成長調節物質および除草剤のような他の活性化化合物との混合物として、例えば活性スペクトルを広げるために、または耐性の発生を防ぐために使用することができる。多くの場合で相乗効果が得られ、すなわち混合物の活性は個々の成分の活性よりも高い。殺虫剤には例えば、リン酸エステル、カルバメート、カルボキシレート、塩化炭化水素、フェニルウレアおよびとりわけ微生物により生産された物質を含む。

10

【0264】

適当な共成分 (co-component) は、例えば以下の化合物である：

殺菌・殺カビ剤：

アルジモルホ (aldimorph)、アムプロピルホス (ampropylfos)、アムプロピルホス (ampropylfos) - カリウム、アンドプリム (andopr im)、アニラジン (anilazine)、アザコナゾール (azaconazole)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、

ベナラキシル (benalaxy l)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomy l)、ベンザマクリル (benzamacril)、ベンザマクリル (benzamacril) - イソブチル、ビアラホス (bialaphos)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ビタータノール (bittertanol)、プラスチックジン (blasticidin) - S、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ブピリメート (bupirimate)、ブチオベート (buthiobate)、

20

ポリスルフィド カルシウム、カプシマイシン (capsimycin)、カプタホル (captafol)、カプタン (captan)、カルベンダジン (carbendazim)、カルボキシ (carboxin)、カルボン (carvon)、キノメチオネート (quinomethionate)、クロベンチアゾン (chlobenthiazole)、クロルフエナゾール (chlorfenazole)、クロロネブ (chloroneb)、クロロピクリン (chloropicrin)、クロロサロニル (chlorothalonil)、クロゾリネート (chlozolin ate)、クロジラコム (clozylacon)、クフラネブ (cufraneb)、シモキサニル (cymoxanil)、シプロコナゾール (ciproconazole)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフラム (cyprofuram)、

30

デバカルブ (debacarb)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジクロブトラゾール (diclobutrazole)、ジクロフルアニド (diclofluanid)、ジクロメジン (diclomezine)、ジクロラン (dicloran)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジメチリモール (dimethirimol)、ジメトモルホ (dimethomorph)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジニコナゾール (diniconazole) - M、ジノカプ (dinocap)、ジフェニルアミン、ジピリチオン (dipyrrithione)、ジタリムホス (ditalimfos)、ジチアノン (dithianon)、ドデモルホ (dodemorph)、ドジン (dodine)、ドラゾキソロン (drazoxolon)、

40

エジフェンホス (edifenphos)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、エタコナゾール (etaconazole)、エチルモル (ethirimol)、エトリジアゾール (etrizidiazole)、

ファモキサドン (famoxadon)、フェナパニル (fenapanil)、フェナリモル (fenarimol)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェンフラム (fenfuram)、フェニトロパン (fenitropan)、フェン

50

ピクロニル (fenpiclonil)、フェンプロピジン (fenpropidin)、
 フェンプロピモルホ (fenpropimorph)、フェンチン (fentin) ア
 セテート、フェンチン (fentin) ヒドロキシド、フェルバム (ferbam)、
 フェリムゾーン (ferimzone)、フルアジナム (fluazinam)、フルメ
 トベル (flumetover)、フルオロミド (fluoromide)、フルキンコ
 ナゾール (fluquinconazole)、フルルプリミドール (flurprim
 idol)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flus
 ulfamide)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアホル (flu
 triafol)、ホルベット (folpet)、ホセチル (fosetyl) ーアルミ
 ニウム、ホセチル (fosetyl) ーナトリウム、フタリド (fthalide)、フ
 ベリダゾール (fuberidazole)、フララキシル (furalaxyl)、フ
 ラメトピル (furametpyr)、フルカルボニル (furcarbonil)、フ
 ルコナゾール (furconazole)、フルコナゾール (furconazole)
 ーシス、フルメシクロックス (furmecycloxx)、
 グアザチン (guazatine)、
 ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヒメキサゾー
 ル (hymexazole)、
 イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)
)、イミノクタジン (iminooctadine)、イミノクタジンアルベシレート (i
 minooctadine albesilate)、イミノクタジン (iminoocta
 dine) トリアセテート、ヨードカルブ (iodocarb)、イプコナゾール (ip
 conazole)、イプロベンホス (iprobentfos: IBP)、イプロジオン
 (iprodone)、イルママイシン (irumamycin)、イソプロチオラン
 (isoprothiolane)、イソバレジオン (isovalledione)、
 カスガマイシン、クレソキシム (kresoxim) ーメチル：水酸化銅、ナフテン酸銅
 、銅オキシクロライド、硫酸銅、酸化銅、オキシニール銅およびボルドー混合物のような銅
 調製物、
 マンコッパー (mancopper)、マンコゼブ (mancozeb)、マネブ (ma
 neb)、メフェリムゾーン (meferimzone)、メパニピリム (mepani
 pyrim)、メプロニル (mepironil)、メタラキシル (metalaxyl)
 、メトコナゾール (metconazole)、メタスルホカルブ (methasulf
 ocarb)、メトフロキサム (methfuroxam)、メチラム (metiram)
)、メトメクラム (metomeclam)、メトスルホバックス (metsulfov
 ax)、ミルジオマイシン (mildiomycin)、ミクロブタニル (myclob
 utanil)、ミクロゾリン (myclozolin)、
 ニッケル ジメチルジチオカルバメート、ニトロサル (nitrothal) ーイソプロ
 ピル、ニュアリモル (nuarimol)、
 オフラス (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキサモカルブ
 (oxamocarb)、オキソリン酸、オキシカルボキシム (oxycarboxim
)、オキシフェンチン (oxyfenthion)、
 パクロブトラゾール (paclobutrazole)、ペフラゾエート (pefura
 zoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ペンシキュロン (penc
 ycuron)、ホスジフェン (phosdiphen)、ピコキシストロビン (poc
 oxystrobin)、ピマリシン (pimaricin)、ピペラリン (piper
 alin)、ポリオキシム (polyoxin)、ポリオキシリム (polyoxori
 m)、プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochlora
 z)、プロシミドン (procymidone)、プロパモカルブ (propamoca
 rb)、プロパノシン (propanosine) ーナトリウム、プロピコナゾール (p
 ropiconazole)、プロピネブ (propineb)、ピラクロストロビン (p
 yraclostrobin)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリフェノッ

10

20

30

40

50

クス (pyrifenoX)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロクイロン (pyroquilon)、ピロキシフル (pyroxyfur)、
キンコナゾール (quinconazole)、キントゼン (quintozene: PCNB)、

硫黄および硫黄調製物、

テブコナゾール (tebuconazole)、テクロフタラム (teclotalam)、
テクナゼン (tecnazene)、テトシクラシス (tetcyclacis)、
テトラコナゾール (tetraconazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、
チシオフエン (thicyofen)、チフルザミド (thi fluzamide)、
チオファネート (thiophanate) - メチル、チラム (thi ram) 10
チオキシミド (tioxyimid)、トルクロホス (tolclofos) -
メチル、トリルフルアニド (tolylfluaniid)、トリアジメホン (triadimefon)、
トリアジメノール (triadimenol)、トリアズブチル (triazbutyl)、
トリアゾキシド (triazoxide)、トリクラミド (trichlamide)、
トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルホ (tridemorph)、
トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、
トリフルミゾール (triflumizole)、トリホリン (triforine)、
トリチコナゾール (triticonazole)、

ユニコナゾール (uniconazole)、

バリダマイシン (validamycin) A、ビンクロゾリン (vinclozolin) 20
ビニコナゾール (viniconazole)、
ザリラミド (zarilamide)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram)、
ならびにまた

Dagger G、OK-8705、OK-8801、

α - (1, 1-ジメチルエチル) - β - (2-フェノキシエチル) - 1H-1, 2, 4-
トリアゾール-1-エタノール、

α - (2, 4-ジクロロフェニル) - β - フルオロ - β - プロピル-1H-1, 2, 4-
トリアゾール-1-エタノール、

α - (2, 4-ジクロロフェニル) - β - メトキシ - α - メチル-1H-1, 2, 4-
トリアゾール-1-エタノール、 30

α - (5-メチル-1, 3-ジオキサ-5-イル) - β - [[4- (トリフルオロメチル) -
フェニル] - メチレン] - 1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-エタノール、

(5RS, 6RS) - 6-ヒドロキシ-2, 2, 7, 7-テトラメチル-5- (1H-1,
2, 4-トリアゾール-1-イル) - 3-オクタノン、

(E) - α - (メトキシイミノ) - N-メチル-2-フェノキシ-フェニルアセトアミド
、

イソプロピル {2-メチル-1- [[[1- (4-メチルフェニル) - エチル] - アミノ]
- カルボニル] - プロピル} - カルバメート、

1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 2- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)
- エタノン - O- (フェニルメチル) - オキシム、 40

1- (2-メチル-1-ナフタレニル) - 1H-ピロール-2, 5-ジオン、

1- (3, 5-ジクロロフェニル) - 3- (2-プロペニル) - 2, 5-ピロリジンジオン、

1- [(ジヨードメチル) - スルホニル] - 4-メチル-ベンゼン、

1- [[2- (2, 4-ジクロロフェニル) - 1, 3-ジオキサラン-2-イル] - メチル]
- 1H-イミダゾール、

1- [[2- (4-クロロフェニル) - 3-フェニルオキシラニル] - メチル] - 1H-
1, 2, 4-トリアゾール、

1- [1- [2- [(2, 4-ジクロロフェニル) - メトキシ] - フェニル] - エテニル]
- 1H-イミダゾール、 50

- 1-メチル-5-ノニル-2-(フェニルメチル)-3-ピロリジノール、
 2', 6'-ジブロモ-2-メチル-4'-トリフルオロメトキシ-4'-トリフルオロ
 -メチル-1, 3-チアゾール-5-カルボキサニリド、
 2, 2-ジクロロ-N-[1-(4-クロロフェニル)-エチル]-1-エチル-3-メ
 チル-シクロプロパンカルボキサミド、
 2, 6-ジクロロ-5-(メチルチオ)-4-ピリミジニル-チオシアネート、
 2, 6-ジクロロ-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)-ベンズアミド、
 2, 6-ジクロロ-N-[4-(トリフルオロメチル)-フェニル]-メチル]-ベン
 ズアミド、
 2-(2, 3, 3-トリヨード-2-プロペニル)-2H-テトラゾール、
 2-[(1-メチルエチル)-スルホニル]-5-(トリクロロメチル)-1, 3, 4-
 チアジアゾール、
 2-[[6-デオキシ-4-O-(4-O-メチル-β-D-グリコピラノシル)-α-
 D-グリコピラノシル]-アミノ]-4-メトキシ-1H-ピロロ[2, 3-d]ピリミ
 ジン-5-カルボニトリル、2-アミノブタン、
 2-ブロモ-2-(プロモメチル)-ペンタンジニトリル、
 2-クロロ-N-(2, 3-ジヒドロ-1, 1, 3-トリメチル-1H-インデン-4-
 イル)-3-ピリジンカルボキサミド、
 2-クロロ-N-(2, 6-ジメチルフェニル)-N-(イソチオシアナトメチル)-ア
 セトアミド、
 2-フェニルフェノール(OPP)、
 3, 4-ジクロロ-1-[4-(ジフルオロメトキシ)-フェニル]-1H-ピロール-
 2, 5-ジオン、
 3, 5-ジクロロ-N-[シアノ(1-メチル-2-プロピニル)-オキシ]-メチル]
 -ベンズアミド、
 3-(1, 1-ジメチルプロピル)-1-オキソ-1H-インデン-2-カルボニトリル
 、
 3-[2-(4-クロロフェニル)-5-エトキシ-3-イソキサゾリジニル]-ピリジ
 ン、
 4-クロロ-2-シアノ-N, N-ジメチル-5-(4-メチルフェニル)-1H-イミ
 ダゾール-1-スルホンアミド、
 4-メチル-テトラゾロ[1, 5-a]キナゾキリン-5(4H)-オン、
 8-(1, 1-ジメチルエチル)-N-エチル-N-プロピル-1, 4-ジオキサスピロ
 [4.5]デカン-2-メタンアミド、
 8-ヒドロキシキノリン スルフェート、
 9H-キサンテン-2-[(フェニルアミノ)-カルボニル]-9-カルボン酸ヒドラジ
 ド、ビス-(1-メチルエチル)-3-メチル-4-[(3-メチルベンゾイル)-オ
 キシ]-2, 5-チオフエンジカルボキシレート、
 シス-1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル
)-シクロヘプタノール、
 シス-4-[3-[4-(1, 1-ジメチルプロピル)-フェニル-2-メチルプロピル
]-2, 6-ジメチル-モルホリン ヒドロクロライド、
 エチル[(4-クロロフェニル)-アゾ]-シアノアセテート、
 重炭酸カリウム、
 メタンテトラチオール ナトリウム塩、
 メチル 1-(2, 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-1H-インデン-1-イル)-1
 H-イミダゾール-5-カルボキシレート、
 メチル N-(2, 6-ジメチルフェニル)-N-(5-イソキサゾリルカルボニル)-
 DL-アラニネート、
 メチル N-(クロロアセチル)-N-(2, 6-ジメチルフェニル)-DL-アラニネ

10

20

30

40

50

ート、
 N-（2，3-ジクロロ-4-ヒドロキシフェニル）-1-メチル-シクロヘキサンカルボキサミド、
 N-（2，6-ジメチルフェニル）-2-メトキシ-N-（テトラヒドロ-2-オキソ-3-フラニル）-アセトアミド、
 N-（2，6-ジメチルフェニル）-2-メトキシ-N-（テトラヒドロ-2-オキソ-3-チエニル）-アセトアミド、
 N-（2-クロロ-4-ニトロフェニル）-4-メチル-3-ニトロ-ベンゼンスルホンアミド、
 N-（4-シクロヘキシルフェニル）-1，4，5，6-テトラヒドロ-2-ピリミジンアミン、 N-（4-ヘキシルフェニル）-1，4，5，6-テトラヒドロ-2-ピリミジンアミン、
 N-（5-クロロ-2-メチルフェニル）-2-メトキシ-N-（2-オキソ-3-オキサゾリジニル）-アセトアミド、
 N-（6-メトキシピリジン-3-イル）-シクロプロパンカルボキサミド、
 N-[2，2，2-トリクロロ-1-[(クロロアセチル)-アミノ]-エチル]-ベンズアミド、 N-[3-クロロ-4，5-ビス-(2-プロピニルオキシ)-フェニル]-N'-メトキシ-メタンイミドアミド、
 N-ホルミル-N-ヒドロキシ-DL-アラニン-ナトリウム塩、
 O，O-ジエチル[2-(ジプロピルアミノ)-2-オキソエチル]-エチルホスホラミドチオエート、
 O-メチル S-フェニル フェニルプロピルホスホラミドチオエート、
 S-メチル 1，2，3-ベンゾチアジアゾール-7-カルボチオエート、
 スピロ[2H]-1-ベンゾピラン-2，1'-(3'H)-イソベンゾフラン]-3'-オン、
 4-[(3，4-ジメトキシフェニル)-3-(4-フルオロフェニル)-アクリロイル]-モルホリン

殺菌剤：

ブロンポル (bronopol)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ニトラピリン (nitrapyrin)、ニッケル ジメチルジチオカルバメート、カスガマイシン、オクチリノン (octhilinone)、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾール (probenazole)、ストレプトマイシン、テクロフトラム (tecloftalam)、硫酸銅および他の銅調製物。

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤：

アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセタアミプリド (acetamiprid)、アクリナトリン (acrinathrin)、アラニカルブ (alanycarb)、アルジカルブ (aldicarb)、アルドキシカルブ (aldoxycarb)、アルファ-シペルメトリン (alpha-cypermethrin)、アルファメトリン (alphamethrin)、アミトラズ (amitraz)、アベルメクチン (avermectin)、AZ 60541、アザジラクチン (azadirachtin)、アザメチホス (azamethiphos)、アジンホス (azinphos) A、アジンホス (azinphos) M、アゾシクロチン (azocyclotin)、
 バチルス ポピリーア (Bacillus popilliae)、バチルス スフェリカス (Bacillus sphaericus)、バチルス ズブチルス (Bacillus subtilis)、バチルス サーリングエンシス (Bacillus thuringiensis)、バキュロウイルス、ビューベリア バッシャーナ (Beauveria bassiana)、ビューベリア テネーラ (Beauveria tenella)、ベンジオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ベンスルタブ (bensultap)、ベンゾキシメート (benzoxima

te)、ベーターシフルトリン (betacyfluthrin)、ビフェナゼート (bifenazate)、ビフェントリン (bifenthrin)、バイオエタノメトリン (bioethanomethrin)、バイオパーメトリン (biopermethrin)、ビストリフルロン (bistrifluron)、BPMC、プロモホス (bromophos) A、ブフェンカルブ (bufencarb)、ブプロフェジン (buprofezin)、ブタチオホス (butathiofos)、ブトカルボキシム (butocarboxim)、ブチルピリダベン (butylpyridaben)、カズサホス (cadusafos)、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボフェノチオン (carbophenothion)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルタプ (cartap)、クロエトカルブ (chloethocarb)、クロルエトキシホス (chlorethoxyfos) 10
)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロルメホス (chlormephos)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホス (chlorpyrifos) M、クロバポルトリン (chlorvaporthrin)、クロマフェノジド (chromafenozide)、シスーレスメトリン (resmethrin)、シスパーメトリン (cispermethrin)、クロシトリン (clocythrins)、クロエトカルブ (chloethocarb)、クロフェンテジン (clofentazine)、クロチアミジン (clothiamidine)、シアノホス (cyanophos)、シクロブレン (cyclopren) 20
 e)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、シフルトリン (cyfluthrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、シヘキサチン (cyhexatin)、シパーメトリン (cypermethrin)、シロマジン (cyromazine)、
 デルタメトリン (deltamethrin)、デメトン (demeton) M、デメトン (demeton) S、デメトン (demeton) -S-メチル、ジアフェンチユロン (diafenthionuron)、ジアジノン (diazinon)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジコホル (dicofol)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジメトエート (dimethoate)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジオフェノラン (diofenolan)、ジスル 30
 ホトン (disulfoton)、ドクサット (docusate) -ナトリウム、ドフェナピン (dofenapyn)、
 エフルシラネート (eflusalanate)、エマメクチン (emamectin)、エムペントリン (empenthrin)、エンドスルファン (endosulfan)、エントモフソーラ種 (Entomopftthora spp.)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、エチオン (ethion)、エトプロホス (ethoprophos)、エトフェンプロックス (etofenprox)、エトキサゾール (etoxazole)、エトリムホス (etrimofos)、
 フェナミホス (fenamiphos)、フェナザキン (fenazaquin)、フェ 40
 ンブタチン (fenbutatin) オキシド、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェノキサクリム (fenoxacrim)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンピラド (fenpyrad)、フェンピリトリン (fenpyrithrin)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フェンバレレート (fenvalerate)、フィプロニル (fipronil)、フルアジナム (fluazinam)、フルアズロン (fluazuron)、フルブロシトリネート (flubrocycythrinate)、フルシクロキユロン (flucycloxuron)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルフェノキユロン (flufenoxuron)、フルメトリン (flumethrin)、フルテ 50

ンジン (flutenzine)、フルバリネート (fluvalinate)、ホノホ
 ス (fonophos)、ホスメチラン (fosmethilan)、ホスチアゼート (fosthiazate)、フブフェンプロックス (fubfenprox)、フラチオ
 カルブ (furathiocarb)、

顆粒症ウイルス、

ハロフェノジド (halofenozide)、HCH、ヘプテノホス (heptenophos)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、ヒドロプレン (hydroprene)、

イミダクロピリド (imidacloprid)、インドキサカルブ (indoxacarb)、イサゾホス (isazofos)、イソフェンホス (isofenphos)、
 イソキサチオン (isoxathion)、イベルメクチン (ivermectin)、
 核多角体病ウイルス、

ラムダーシハロトリン (cyhalothrin)、ルフェニュロン (lufenuron)、

マラチオン、メカルバム (mecarbam)、メタルデヒド (metaldehyde)、メサミドホス (methamidophos)、メサルヒジウム アニソプリエ (Metharhizium anisopliae)、メサルヒジウム フラボビリデ (Metharhizium flavoviride)、メチダチオン (methidathion)、メチオカルブ (methiocarb)、メトプレン (methoprene)、
 メトミル (methomyl)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、メトルカルブ (metolcarb)、メトキサジアゾン (methoxadiazon)、メビンホス (mevinphos)、ミルベメクチン (milbemectin)、ミルベマイシン (milbemycin)、モノクロトホス (monocrotophos)、

ナレド (naled)、ニテンピラン (nitenpyram)、ニチアジン (nithiazine)、ノバルロン (novaluron)、

オメトエート (omethoate)、オキサミル (oxamyl)、オキシデメトン (oxydemeton) M、

パシロマイセス フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus)、パラチオン A、パラチオン M、パーメトリン (permethrin)、フェント
 エート (phenthoate)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスメト (phosmet)、ホスファミドン (phosphamidon)、
 フォキシム (phoxim)、ピリミカルブ (pirimicarb)、ピリミホス (pirimiphos) A、ピリミホス (pirimiphos) M、プロフェノホス (profenofos)、プロメカルブ (promecarb)、プロパルギット (propargite)、プロポクスル (propoxur)、プロチオホス (prothiofos)、プロソエート (prothoate)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピレスメトリン (pyresmethrin)、ピレスラン (pyrethrum)、ピリダベン (pyridaben)、
 ピリダチオン (pyridathion)、ピリミジフェン (pyrimidifen)
)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、

キナルホス (qunalphos)、

リバビリン (ribavirin)、

サリチオン (salithion)、セブホス (sebufos)、シラフルオフエン (silaflofen)、スピノサド (spinosad)、スピロジクロフェン (spirodiclofen)、スルホテプ (sufotep)、スルプロホス (sulprofos)、

タウフルバリネート (fluvalinate)、テブフェノジド (tebufenozide)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、テブピリミホス (tebupirimiphos)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、テフル

10

20

30

40

50

トリン (tefluthrin)、テムホス (temephos)、テミビンホス (temiviphos)、ターブホス (terbufos)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、テータシペルメトキン (thetacypermethrin)、チアクロピリド (thiacloprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チアプロニル (thiapronil)、チアトリホス (thiatriphos)、チオ酸水素チオシクラム (thiocyclam)、チオジカルブ (thiodicarb)、チオフアノックス (thiofanox)、サーリングエシン (thuringiensin)、トラロシトリン (tralocythrin)、トラロメトリン (tralomethrin)、トリアラテン (triarathene)、トリアザメート (triazamate)、トリアゾホス (triazophos)、トリアズロン (triazurone)、トリクロフェニジン (trichlorophenidine)、トリクロルホン (trichlorfon)、トリフルムロン (triflumuron)、トリメタカルブ (trimethacarb)、
 バミドチオン (vamidothion)、バニリプロール (vaniliprole)、
 パーティシリウム レカニー (Verticillium lecanii)、
 YI5302、
 ゼータシパーメトリン (cypermethrin)、ゾラプロホス (zolaprofos)、
 (1R-シス) - [5-(フェニルメチル) - 3-フラニル] - メチル - 3 - [(ジヒドロ-2-オキソ-3(2H) - フラニリデン) - メチル] - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート、
 (3-フェノキシフェニル) - メチル - 2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート、
 1 - [(2-クロロ-5-チアゾリル) メチル] テトラヒドロ-3, 5-ジメチル-N-ニトロ-1, 3, 5-トリアジン-2(1H) - イミン、
 2 - (2-クロロ-6-フルオロフェニル) - 4 - [4-(1, 1-ジメチルエチル) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-オキサゾール、
 2 - (アセチルオキシ) - 3-ドデシル-1, 4-ナフタレンジオン、
 2-クロロ-N - [[4-(1-フェニルエトキシ) - フェニル] - アミノ] - カルボニル] - ベンズアミド、
 2-クロロ-N - [[4-(2, 2-ジクロロ-1, 1-ジフルオロエトキシ) - フェニル] - アミノ] - カルボニル] - ベンズアミド、
 3-メチルフェニルプロピルカルバメート、
 4 - [4-(4-エトキシフェニル) - 4-メチルフェニル] - 1-フルオロ-2-フェノキシ-ベンゼン、
 4-クロロ-2 - (1, 1-ジメチルエチル) - 5 - [[2-(2, 6-ジメチル-4-フェノキシフェノキシ) エチル] チオ] - 3(2H) - ピリダジノン、
 4-クロロ-2 - (2-クロロ-2-メチルプロピル) - 5 - [(6-ヨード-3-ピリジニル) メトキシ] - 3(2H) - ピリダジノン、
 4-クロロ-5 - [(6-クロロ-3-ピリジニル) メトキシ] - 2 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 3(2H) - ピリダジノン、
 バチルス サーリングエンシス (Bacillus thuringiensis) EG-2348株、
 [2-ベンゾイル-1 - (1, 1-ジメチルエチル) - ヒドラジノ安息香酸、
 2, 2-ジメチル-3 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 2-オキソ-1-オキサスピロ[4.5]デセ-3-エン-4-イル ブタノエート、
 [3 - [(6-クロロ-3-ピリジニル) メチル] - 2-チアゾリジニリデン] - シアナミド、ジヒドロ-2 - (ニトロメチレン) - 2H-1, 3-チアジン-3(4H) - カルボキシアルデヒド、
 エチル [2 - [[1, 6-ジヒドロ-6-オキソ-1 - (フェニルメチル) - 4-ピリダ

ジニル] オキシ] エチル] カルバメート、
 N- (3, 4, 4-トリフルオロ-1-オキソ-3-ブテニル) -グリシン、
 N- (4-クロロフェニル) -3- [4- (ジフルオロメトキシ) フェニル] -4, 5-
 ジヒドロ-4-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド、
 N- [(2-クロロ-5-チアゾリル) メチル] -N'-メチル-N''-ニトロ-グア
 ニジン、
 N-メチル-N''- (1-メチル-2-プロペニル) -1, 2-ヒドラジンジカルボチ
 オアミド、
 N-メチル-N'-2-プロペニル-1, 2-ヒドラジンジカルボチオアミド、
 O, O-ジエチル [2- (ジプロピルアミノ) -2-オキソエチル] -エチルホスホラミ
 ドチオエート、
 3, 5-ジクロロ-1- (3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ) -4- [3- (5-
 -トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ) プロポキシ] -ベンゼン。

10

20

30

40

50

【0265】

除草剤または肥料、および成長調節物質のような他の既知の活性化合物と混合することも可能である。

【0266】

殺虫剤として使用する時、本発明の活性化合物はさらにそれらの市販されている製剤およびそれら製剤から調製された使用形態で、相乗剤との混合物として存在することができる。相乗剤とは、加える相乗剤がそれ自体活性となる必要はないが、本発明による活性化合物の作用を増大させる化合物である。

【0267】

市販の製剤から調製された使用状態の活性化合物含量は、広い限度内で変動し得る。使用状態の活性化合物の濃度は、0.0000001-95重量%、好ましくは0.0001から1重量%の間の活性化合物である。

【0268】

化合物は、使用状態に適する通常の様式で使用される。

【0269】

衛生上の有害生物および貯蔵産物中の有害生物に対して使用する時、活性化合物は、木材およびクレーに対する優れた残存作用、ならびに石灰化物質のアルカリに対する良好な安定性を有する。

【0270】

すでに上で述べたように、本発明に従い植物全体およびそれらの部分を処理することが可能である。好適な態様では、野生型植物種および植物栽培変種、または交差もしくはプロトプラスト融合のような通例の生物学的育種により得られるもの、およびそれらの部分を処理する。さらに好適な態様では、適当ならば常法と組み合わせて遺伝子操作により得られるトランスジェニック植物および植物栽培変種（遺伝的に修飾された生物）、およびそれらの部分を処置する。用語「部分」または「植物の部分」または「植物部分」は、上記に説明した。

【0271】

特に好ましくは、各々の場合で市販されているか、または使用されている植物栽培変種の植物を本発明に従い処理する。植物栽培変種とは、通例の育種により、突然変異誘発法により、または遺伝子操作により得られた特定の特性（「形質」）を有する植物を意味すると考える。これは品種、生物-および遺伝子型であることができる。

【0272】

植物種または植物栽培変種、それらの場所および生育条件（土壌、気候、生長期間、肥料（diet））に依存して、本発明の処理は付加的（superadditive）（相乗）効果をもたらすことができる。すなわち例えば、低減した施用率および／または活性スペクトルを広げること、および／または本発明に従い使用する物質および組成物の活性の上昇、より良好な植物の成長、高または低温に対する耐性の上昇、渇水または水または

土壌の塩含量に対する耐性の上昇、花成性能 (flowering performance) の増加、より容易な収穫、成熟の加速、より高い収穫量、収穫した生産物のより良い品質および／またはより高い栄養価、収穫した生産物のより良い保存安定性および／または加工性が実際に期待された効果を越えて可能である。

【0273】

本発明に従い処置するために好適であるトランスジェニック植物および植物栽培変種 (すなわち、遺伝子操作により得られる植物) には、遺伝子修飾でこれらの植物に特に有利な有用な形質を与える遺伝子を受容したすべての植物を含む。そのような形質の例には、より良い植物の成長、高または低温に対する耐性の上昇、渇水または水または土壌の塩含量に対する耐性の上昇、花成性能の上昇、より容易な収穫、成熟の加速、より高い収穫量、収穫した生産物のより良い品質および／またはより高い栄養価、収穫した生産物のより良い保存安定性および／または加工性である。そのような形質のさらなる、そして特に強調される例には、昆虫、ダニ、植物病原性の菌類、バクテリアおよび／またはウイルスのような動物および微生物有害生物に対する植物のより良い防御、ならびにまた特定の殺草的に活性な化合物に対する植物の耐性の上昇を含む。挙げることができるトランスジェニック植物の例は、穀類 (コムギ、コメ)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、綿、ナタネおよびまた果実植物 (果実をつけるリンゴ、ナシ、柑橘類およびブドウのつる) のような重要な作物であり、そして特にトウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、綿およびナタネが強調される。強調される形質は、特に植物中で形成される、特にバチルス サーリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する遺伝材料により植物中形成されるトキシンによる昆虫に対する植物の上昇した防御である (例えば遺伝子 Cry I A (a)、Cry I A (b)、Cry I A (c)、Cry I I A、Cry I I I A、Cry I I I B 2、Cry 9 c、Cry 2 A b、Cry 3 B b および Cry I F、ならびにまたそれらの組み合わせである) (今後、“Bt 植物”と呼ぶ)。また特に強調される形質は、菌・カビ、バクテリアおよびウイルスに対して、全身獲得抵抗性 (SAR)、システミンの、フィトアレキシンの、エリシターの、および耐性の遺伝子および対応して発現したタンパク質およびトキシンによる植物の上昇した防御である。さらに特に強調される形質は、特定の殺草的に活性な化合物、例えばイミダゾリノン、スルホニルウレア、グリホセートまたはホスフィノトリシンに対する植物の上昇した耐性である (例えば“PAT”遺伝子)。問題の所望する形質を与える遺伝子は、トランスジェニック植物中で互いに組合わさって存在することもできる。挙げることができる“Bt 植物”の例は、トウモロコシの変種、ワタの変種、ダイズの変種およびジャガイモの変種であり、これらは商標名 YIELD GARD (商標) (例えばトウモロコシ、ワタ、ダイズ)、Knock Out (商標) (例えばトウモロコシ)、StarLink (商標) (例えばトウモロコシ)、Bollgard (商標) (ワタ)、Nucotn (商標) (ワタ) および New Leaf (商標) (ジャガイモ) で販売されている。挙げることができる除草剤耐性植物の例は、トウモロコシの変種、ワタの変種およびダイズの変種であり、これらは商標名 Roundup Ready (商標) (例えばグリホセートに対する耐性、例えばトウモロコシ、ワタ、ダイズ)、Liberty Link (商標) (ホスフィノトリシンに対する耐性、例えばナタネ)、IMI (商標) (イミダゾリノンに対する耐性)、および STS (商標) (スルホニルウレアに対する耐性、例えばトウモロコシ) で販売されている。挙げることができる除草剤耐性植物 (除草剤耐性について通例の様式で育種した植物) は、Clearfield (商標) (例えばトウモロコシ) の名で販売されている変種を含む。もちろんこれらの提示はこれらのまたは開発中の遺伝形質を有する植物栽培変種にも応用され、これらの植物は将来、開発され、かつ／または市場に出るだろう。

【0274】

掲げた植物は本発明に従い、本発明の一般式 I の化合物および／または活性化合物の混合物を用いて特に有利な様式で処理することができる。活性化合物または混合物について上に述べた好適な範囲は、これらの植物の処理にも適用する。特に強調されるのは、植物を本明細書に具体的に述べる化合物または混合物で処理することである。

10

20

30

40

50

【0275】

本発明の活性化合物は、植物、衛生上の、および貯蔵産物の有害生物に対して活性であるだけでなく、獣医学分野において、マダニ、ヒメダニ、キュウセンヒゼンダニ、ツツガムシ、ハエ（刺し、そして吸血性の）、寄生性のハエの幼虫、シラミ、ケシラミ、羽シラミおよびノミのような動物寄生体（外部寄生体）に対しても活性である。これらの寄生体には以下のものを含む：

シラミ目（Anoplurida）から、例えばヘマトピナス種（Haematopinus spp.）、リノグナthus種（Linognathus spp.）、ペディキュラス種（Pediculus spp.）、フィチラス種（Phthirus spp.）およびソレノポテス種（Solenopotes spp.）。

10

【0276】

ハジラミ目（Mallophagida）および鈍角亜目（suborders Amblyceria）および細角亜目（suborders Ischnoceria）から、例えばトリメノポン種（Trimenopon spp.）、メノポン種（Menopon spp.）、トリノトン種（Trinoton spp.）、ボビコーラ種（Bovicola spp.）、ウェルネッキエーラ種（Werneckiella spp.）、レピケントロン種（Lepikentron spp.）、ダマリナ種（Damalina spp.）、トリコデクテス種（Trichodectes spp.）およびフェリコーラ種（Felicola spp.）。

【0277】

双翅目（Diptera）ならびに長角亜目（suborders Nematocerina）および短角亜目（suborders Brachycerina）から、例えばアエデス種（Aedes spp.）、アノフェレス種（Anopheles spp.）、クレックス種（Culex spp.）、シムリウム種（Simulium spp.）、ユーシムリウム種（Eusimulium spp.）、フレボトウム種（Phlebotomus spp.）、ルトゾミア種（Lutzomyia spp.）、クリコイデス種（Culicoides spp.）、クリソプス種（Chrysops spp.）、ヒボミトラ種（Hybomitra spp.）、アチロタス種（Atylotus spp.）、タバナス種（Tabanus spp.）、ヘマトポータ種（Haematopota spp.）、フィリポミア種（Philipomyia spp.）、ブラウラ種（Braula spp.）、ムスカ種（Musca spp.）、ヒドロタエ種（Hydrotaea spp.）、ストモキス種（Stomoxys spp.）、ヘマトビア種（Haematobia spp.）、モレリア種（Morellia spp.）、ファンニア種（Fannia spp.）、グロッシナ種（Glossina spp.）、カリホーラ種（Calliphora spp.）、ルシリア種（Lucilia spp.）、クリソミア種（Chrysomyia spp.）、ウォールファルティア種（Wohlfahrtia spp.）、サルコファーガ種（Sarcophaga spp.）、オエストラス種（Oestrus spp.）、ハイポダーマ種（Hypoderma spp.）、ガステロフィラス種（Gasterophilus spp.）、ヒッポボスカ種（Hippobosca spp.）、リポプテナ（Lipoptena spp.）およびメロファーガス種（Melophagus spp.）。

20

30

40

【0278】

微翅目（Siphonapterida）から、例えばプレックス種（Pulex spp.）、シテノセファリデス種（Ctenocephalides spp.）、キセノプシーラ種（Xenopsylla spp.）およびセラトフィラス種（Ceratophyllus spp.）。

【0279】

異翅目（Heteropterida）から、例えばシメックス種（Cimex spp.）、トリアトーマ種（Triatoma spp.）、ロドニウス種（Rhodnius spp.）およびパンストロンギラス種（Panstrongylus spp.）。

50

【0280】

網翅目 (Blattarida) から、例えばブラッタ オリエンタリス (Blattorientalis)、ペリプラネタ アメリカーナ (Periplaneta americana)、ブラッテラ ゲルマニカ (Blattella germanica) およびスぺーラ種 (Supella spp.)。

【0281】

ダニ目 (コナダニ科) の亜綱 [subclass of the Acaria (Acarida)] ならびにメタ (Mrtar) およびメソスティグマータ (Mesostigmata) から、例えばアルガス種 (Argas spp.)、オルニソドラス種 (Ornithodoros spp.)、オトビウス種 (Otobius spp.)、イクソデス種 (Ixodes spp.)、アムブリオンマ種 (Amblyomma spp.)、ボーフィラス種 (Boophilus spp.)、ダーマセクター種 (Dermacentor spp.)、ヘモフィサリス種 (Haemaphysalis spp.)、ヒアロンマ種 (Hyalomma spp.)、リピセファラス種 (Rhipicephalus spp.)、ダーマニスサス種 (Dermanyssus spp.)、ライルリエチア種 (Raillietia spp.)、ニューモニッサス種 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストーマ種 (Sternostoma spp.) およびバローア種 (Varroa spp.)。

【0282】

アクチネディダ (Actinedida) 目 (プロスティグマータ: Prostigmata) およびアカリディダ (Acaridida) 目 (アスティグマータ: Astigmata) から、例えばアカラピス種 (Acarapis spp.)、ケイレチエーラ種 (Cheyletiella spp.)、オルニトケイレチア種 (Ornithocheyletia spp.)、ミオビア種 (Myobia spp.)、ソレルゲーテス種 (Psorergates spp.)、デモデックス種 (Demodex spp.)、トロムビクーラ種 (Trombicula spp.)、リストロホラス種 (Listrophorus spp.)、アカラス種 (Acarus spp.)、チロファーガス種 (Tyrophagus spp.)、カログリファス種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス種 (Hypodectes spp.)、プテロリカス種 (Pterolichus spp.)、ソロプテス種 (Psoroptes spp.)、コリオプテス種 (Chorioptes spp.)、オトデクテス種 (Otodectes spp.)、サルコプテス種 (Sarcoptes spp.)、ノトエドレス種 (Notoedres spp.)、クネミドコプテス種 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス種 (Cytodites spp.) およびラミノシオプテス種 (Laminosioptes spp.)。

【0283】

例えば本発明の化合物は、例えばアンブリオンマ ヘブラエム (Amblyomma hebraeum) のようなすべての段階のダニに対して、および例えばヒツジキンバエ (Lucilia cuprina) のような寄生性のハエに対して優れた活性を有する。

【0284】

本発明の式 (I) の活性化合物は、例えば畜牛、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、バッファロー、ウサギ、ニワトリ、七面鳥、カモ、ガンおよびミツバチのような農業用の家畜、例えばイヌ、ネコ、かごの中の鳥、水槽中の魚のような他のペット、および例えばハムスター、モルモット、ラットおよびマウスのようないわゆる実験動物にたかる節足動物を防除するためにも適する。これらの節足動物を防除することにより、死亡率および生産性 (肉、ミルク、ウール、皮、卵、ハチミツ等の) の低下が減るので、本発明の活性化合物を使用することにより、より経済的かつ簡単な動物の維持が可能になる。

【0285】

本発明の活性化合物は獣医学的分野では、例えば錠剤、カプセル、飲料、水薬、粒剤、ペースト、丸薬、フィードスルー法 (feed-through method)、座薬

10

20

30

40

50

の状態の腸溶性投与により、例えば注射（筋肉内、皮下、静脈、腹腔等）、インプラントのような非経口投与により、鼻投与により、例えば浸漬または入浴、噴霧、かけること（pouring-on）およびスポット付加、洗浄、散布の状態での経皮的使用により、ならびにまた活性化化合物を含んで成るカラー、耳タグ、尾の印、脚のバンド、頭絡、マーキングデバイスの作成等のような成型品の補助により、既知の様式で使用される。

【0286】

家畜、家禽、ペット等に投与する時、式（I）の活性化化合物は1－80%の量で活性化化合物を含んで成る製剤（例えば、粉剤、乳剤、自由に流動する組成物）として、直接的に、または100～10,000倍に希釈した後のいずれかで使用することができ、あるいはそれらは薬浴の状態で使用することができる。

10

【0287】

さらに本発明の化合物は、工業用材料を破壊する昆虫に対しても強力な殺虫作用を有することが分かった。

【0288】

以下の昆虫を例として挙げることができるが、限定するものではない：

甲虫類（Beetles）、

ヒロトルペス バジュラス（*Hylotrupes bajulus*）、クロロホルス ピロシス（*Chlorophorus pilosis*）、アノビウム パンクタタム（*Anobium punctatum*）、キセストビウム ルホビロサム（*Xestobium rufovillosum*）、ピチリナス ペクチコルニス（*Ptilinus pecticornis*）、デントロビウム パーチネックス（*Dendrobium pertinex*）、エルノビウス モリス（*Ernobius mollis*）、プリオビウム カルピニ（*Priobium carpini*）、リクタス ブルンネウス（*Lyctus brunneus*）、リクタス アフリカナス（*Lyctus africanus*）、リクタス プラニコリス（*Lyctus planicollis*）、リクタス リネアリス（*Lyctus linearis*）、リクタス プベセンス（*Lyctus pubescens*）、トロゴキシロン エクアール（*Trogoxylon aequale*）、ミンテス ルギコリス（*Minthes rugicollis*）、キシレボラス スペック（*Xyleborus spec.*）、トリプトデンドロン スペック（*Tryptodendron spec.*）、アパテ モナカス（*Apate monachus*）、ボストリカス カプシンス（*Bostrychus capucins*）、ヘテロボストリカス ブルンネウス（*Heterobostrychus brunneus*）、シノキシロン スペック（*Sinoxylon spec.*）、ジノデラス ミヌタス（*Dinoderus minutus*）のような。

20

30

ハサミムシ類（Hymenopterons）、

シレックス ジュベンカス（*Sirex juvenicus*）、ウロセラス ギガス（*Urocerus gigas*）、ウロセラス ギガス タイグナス（*Urocerus gigas taignus*）、ウロセラス オーグル（*Urocerus augur*）のような。

シロアリ類（Termites）、

カロターメス フラビコリス（*Kaloterme flavicollis*）、クリプトターメス ブレビス（*Cryptoterme brevis*）、ヘテロターメス インジコーラ（*Heteroterme indicola*）、レティキュリターメス フラビペス（*Reticuliterme flavipes*）、レティキュリターメス サントネンシス（*Reticuliterme santonensis*）、レティキュリターメス ルシフガス（*Reticuliterme lucifugus*）、マストターメス ダルウィニエンシス（*Mastoterme darwiniensis*）、ゾーテルモプシス ネバデンシス（*Zootermopsis nevadensis*）、コプトテルメス ホルモサヌス（*Coptoterme formosanus*）のような。

40

50

レピスマ サッカリーナ (*Lepisma saccharina*) のようなシミ類 (*Bristle tails*) 。

【0289】

本明細書の内容において、工業用材料は、好ましくはプラスチック、接着剤、サイズ剤、紙および厚紙、なめし革、木材および木製製品、および塗料組成物のような非一生存材料を意味すると考える。

【0290】

木材および木製製品は、特に好ましく昆虫の侵襲から保護される材料である。

【0291】

本発明の薬剤により、またはこれらを含んで成る混合物により保護することができる木材および木製製品とは、例えば：

建築用の製材、木製の梁、枕木、橋梁構造、防波堤、木製乗り物、箱、パレット、コンテナ、電話柱、保温材、木製の窓およびドア、合板、チップボード、建具製品、またはきわめて一般的には建材または結合部の構造に使用される木材製品を意味すると考える。

【0292】

活性化合物はそのまま、濃縮物の状態で、または粉末、粒剤、溶剤、懸濁液、乳剤またはペーストのような一般的な通常の製剤の状態で使用できる。

【0293】

挙げた製剤は、それ自体は周知な方法により、例えば活性化合物を少なくとも1つの溶媒または希釈剤、乳化剤、分散剤および／または結合剤または固定剤、防水剤、もし適当ならば乾燥剤およびUV安定化剤、およびもし適当ならば着色剤および顔料ならびに他の処理補助剤と混合することにより調製できる。

【0294】

木材および木製製品の保護に使用するための殺虫剤組成物または濃縮物は、0.0001-95重量%、特に0.001-60重量%濃度の本発明の活性化合物を含んで成る。

【0295】

使用する組成物および濃縮物の量は、昆虫の性質および発生ならびに媒体に依存する。使用する最適な量は、各々の場合で一連の試験により定めることができる。しかし一般的には、保護する材料に基づき0.0001-20重量%、好ましくは0.001-10重量%の活性化合物を使用することで十分である。

【0296】

使用する溶媒および／または希釈剤は、有機化学溶媒または溶媒混合物、および／または油性または油一型の有機化学溶媒もしくは低揮発性の溶媒混合物、および／または極性の有機化学溶媒または溶媒混合物および／または水、ならびに適当ならば乳化剤および／または湿潤剤である。

【0297】

好ましく使用される有機化学溶媒は、35より高い蒸発数および30℃より高い、好ましくは45℃より高い引火点を有する油性または油一型溶媒である。低揮発性のそのような油性および油一型の水不溶性溶媒として使用される物質は、適当な鉱物油またはそれらの芳香族画分、あるいは鉱物油を含有する溶媒混合物、好ましくはホワイトスピリット、石油および／またはアルキルベンゼンである。

【0298】

170-220℃の沸騰範囲を持つ鉱物油、170-220℃の沸騰範囲を持つホワイトスピリット、250-350℃の沸騰範囲を持つスピンドル油、160-280℃の沸騰範囲を持つ石油または芳香族化合物、テルペンチン油等が有利に使用される。

【0299】

好適な態様では、180-210℃の沸騰範囲を持つ液体脂肪族炭化水素、または180-220℃の沸騰範囲を持つ芳香族および脂肪族炭化水素の高沸騰混合物、および／またはスピンドル油、および／またはモノクロロナフタレン、好ましくはα-モノクロロナフタレンを使用する。

【0300】

35より高い蒸発数および30℃より高い、好ましくは45℃より高い引火点を有する低揮発性の有機油性または油型溶媒は、溶媒混合物が35より高い蒸発数および30℃より高い、好ましくは45℃より高い引火点を有し、しかも殺虫剤／殺菌・殺カビ剤混合物がこの溶媒混合物中で可溶性または乳化性であるならば、高いまたは中程度の揮発性の有機化学溶媒に一部置き換えることもできる。

【0301】

好適な態様に従い、有機化学溶媒または溶媒混合物の一部は、脂肪族の極性有機化学溶媒または溶媒混合物に置き換えられる。例えばグリコールエーテル、エステル等のようなヒドロキシルおよび／またはエステルおよび／またはエーテル基を有する脂肪族の有機化学溶媒が好ましく使用される。 10

【0302】

本発明の内容で使用される有機化学結合剤は、それ自体は既知であり、水で希釈できる、かつ／または使用する有機溶媒溶媒中で可溶性または分散性または乳化性である合成樹脂および／または結合乾燥油であり、特にアクリレート樹脂、ビニル樹脂（例えばポリビニルアセテート）、ポリエステル樹脂、ポリ縮合またはポリ付加樹脂、ポリウレタン樹脂、アルキド樹脂または修飾アルキド樹脂、フェノール樹脂、炭化水素樹脂（インデン／クマロン樹脂のような）、シリコーン樹脂、乾燥植物油および／または乾燥油、および／または天然および／または人工樹脂に基づく物理的な乾燥結合剤から成るか、または含んで成る結合剤である。 20

【0303】

結合剤として使用する人工樹脂は、乳液、分散液または溶液の状態で使用できる。最高10重量%の量のピチュメンまたは歴青質も、結合剤として使用できる。さらにそれ自体既知の着色剤、顔料、防水剤、防臭剤およびインヒビターまたは防錆剤等も使用できる。

【0304】

本発明に従い、組成物または濃縮物は好ましくは、有機化学結合剤として少なくとも1種のアルキド樹脂または修飾アルキド樹脂および／または乾燥植物油を含んで成る。本発明に従い、45重量%より高い、好ましくは50-68重量%の油含量を持つアルキド樹脂が好ましく使用される。

【0305】

上述の結合剤の全て、または幾らかを、固定剤（混合物）または可塑剤（混合物）に置き換えることができる。これらの添加物は、活性化合物の蒸発、および結晶化または沈殿を防止することを意図する。それらは好ましくは、結合剤の0.01-30%（使用した結合剤100%に基づき）と置き換えられる。 30

【0306】

可塑剤は、ジブチル、ジオクチルまたはベンジルブチルフタレートのようなフタル酸エステル、トリブチルホスフェートのようなリン酸エステル、ジー（2-エチルヘキシル）アジペートのようなアジピン酸エステル、ブチルステアレートまたはアミルステアレートのようなステアレート、ブチルオレートのようなオレート、グリセロールエーテルまたはより高分子量のグリコールエーテル、グリセロールエステルおよびp-トルエンスルホン酸エステルのような化学種に由来する。 40

【0307】

固定剤は、例えばポリビニルメチルエーテルのようなポリビニルアルキルエーテル、またはベンゾフェノンもしくはエチレンベンゾフェノンのようなケトンに化学的に基づいている。

【0308】

可能な溶媒または希釈剤は特に水、適当であるならば、上述の1種以上の有機化学溶媒または希釈剤、乳化剤および分散助剤との混合物としての水である。

【0309】

特に効果的な木材の保護は、例えば真空、二重真空または加圧法のような工業的な大規 50

模の浸漬法により達成される。

【0310】

即使用可能な組成物はまた、他の殺虫剤および、適当ならば1種以上の殺菌・殺カビ剤を含んで成ることができる。

【0311】

可能なさならる混合パートナーは、好ましくは国際公開第94/29268号明細書に述べられている殺虫剤および殺菌・殺カビ剤である。この明細書に述べられている化合物は、引用により本明細書に編入する。

【0312】

挙げることができる特に好適な混合パートナーは、クロルピリホス (chlorpyrifos) 10
、ホキシム (phoxim)、シラフルオフイン (silaflofin)、
、アルファメトリン (alphamethrin)、シフルトリン (cifluthrin)、
シパーメトリン (cypermethrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、パーメトリン (permethrin)、イミダクロピリド (imidacloprid)、NI-25、フルフェノキユリン (flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron) およびトランスフルトリン (transfluthrin)、チアクロピリド (thiacloprid)、メトキシフェノキシド (methoxyfenozide) およびトリフルムロン (triflumuron) のような殺虫剤、ならびにエポキシコナゾール (epoxyconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、アザコナゾール (azaconazole) 20
、プロピコナゾール (propiconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、メトコナゾール (metconazole)、イマザリル (imazalil)、ジクロロフルアニド (dichlorofluanid)、トリルフルアニド (tolylflanid)、3-ヨード-2-プロピニル-ブチルカルバメート、N-オクチル-イソチアゾリン-3-オン および 4, 5-ジクロロ-N-オクチルイソチアゾリン-3-オンのような殺菌・殺カビ剤である。

【0313】

同時に本発明の化合物は、船体、スクリーン、ネット、建物、係留設備および信号システムのような塩水または半塩水に接触する物体を汚れに対して保護するためにも使用すること 30
ができる。

【0314】

カンザシゴカイ科 (Serpulidae) のような着生の貧毛綱 (Oligochaeta) による、および種々のレパス (Lepas) およびスカルペルム (Scalpellum) 種のようなレダモルファ (Ledamorphae) 群 (エポシガイ) の貝および種による、またはバラナス (Balanus) またはポリシペス (Pollicipes) 種のようなフジツボ類 (Balanomorpha) (アクロン バルナクルズ: acron barnacles) の種による汚れは、船の摩擦によるドラッグを増し、その結果より高いエネルギー消費およびさらに頻繁な乾ドックでの抵抗により操作コストを著 40
しく上昇させる。

【0315】

藻類、例えばエクトカルプス種 (Ectocarpus sp.) およびセラミウム種 (Ceramiun sp.) による汚れとは別に、属名が蔓脚類 (クリップト クルスタセアンス: cirrped crustaceans) に入る着生性エントモストラカ (Entomostiraka) 群による汚れも特に重要である。

【0316】

驚くべきことには、本発明の化合物は単独または他の活性化合物と組み合わせて、際立った防汚作用を有することがわかった。

【0317】

本発明の化合物を単独または他の活性化合物と組み合わせて使用すると、例えば硫化ビス 50

ー（トリアルキル）、トリ－*n*－ブチルチンラウレート、塩化トリ－*n*－ブチルチン、酸化銅（I）、塩化トリエチルチン、トリ－*n*－ブチル（2－フェニル－4－クロロフェノキシ）チン、酸化トリブチルチン、二硫化モリブデン、アンチモニー オキシド、ポリマー性ブチルチタネート、塩化フェニル（ビスピリジン）－ビスムス、弗化トリ－*n*－ブチルチン、エチレンビスチオカルバミン酸マンガン、ジメチルジチオカルバミン酸亜鉛、エチレンビスチオカルバミン酸亜鉛、2－ピリジンチオール 1－オキシドの亜鉛塩および銅塩、ビスジメチルジチオカルバモイル亜鉛エチレン－ビスチオカルバメート、酸化亜鉛、エチレン－ビスジチオカルバミン酸銅（I）、チオシアン化銅、ナフテン酸銅およびハロゲン化トリブチルチンのような重金属の消費、またはこれら化合物の濃度を実質的に下げて使用できるようになる。

10

【0318】

適当ならば、即使用可能な防汚塗料はさらに他の活性化合物、好ましくは殺藻剤、殺菌・殺カビ剤、除草剤、殺軟体動物剤または他の防汚活性化合物を含んで成ることができる。

【0319】

好ましくは、本発明の防汚組成物と組み合わせる適当な成分は：

2－*tert*－ブチルアミノ－4－シクロプロピルアミノ－6－メチルチオール，3，5－トリアジン、ジクロロフェン（*dichlorophen*）、ジュロン（*diuron*）、エンドサル（*endothal*）、酢酸フェンチン（*fentin acetate*）、イソプロチュロン（*isoproturon*）、メタベンズチアズロン（*metabenzthiazuron*）、オキシフルオロフェン（*oxyfluorfen*）、キノクラミン（*quinoclamine*）およびターブチリン（*terbutryn*）のような殺藻剤；

20

ベンゾ [*b*] チオフェンカルボン酸シクロヘキシルアミド *S*，*S*－ジオキシド、ジクロフルアニド（*dichlofluanid*）、フルオルホルベット（*fluorfolpet*）、3－ヨード－2－プロピニル ブチルカルバメート、トリルフルアニド（*tolylfluanid*）、およびアザコナゾール（*azaconazole*）、シプロコナゾール（*ciproconazole*）、エポキシコナゾール（*epoxyconazole*）、ヘキサコナゾール（*hexaconazole*）、メタコナゾール（*metaconazole*）、プロピコナゾール（*propiconazole*）およびテブコナゾール（*tebuconazol*）のようなアゾールのような殺菌・殺カビ剤；

30

酢酸フェンチン（*fentin acetate*）、メタアルデヒド、メチオカルブ（*methiocarb*）、ニクロサミド（*niclosamid*）、チオジカルブ（*thiodicarb*）およびトリメタカルブ（*trimethacarb*）のような殺軟体動物剤；

あるいは

4，5－ジクロロ－2－オクチル－4－イソチアゾリン－3－オン、ジヨードメチルパラトリル スルホン、2－（*N*，*N*－ジメチルチオカルバモイルチオ）－5－ニトロチアジール、2－ピリジンチオール 1－オキシドのカリウム、銅、ナトリウムおよび亜鉛塩、ピリジン－トリフェニルボラン、テトラブチルジスタンノキサン、2，3，5，6－テトラクロロ－4－（メチルスルホニル）－ピリジン、2，4，5，6－テトラクロロイソフタロニトリル、テトラメチルチウラム ジスルフィドおよび2，4，6トリクロロフェニルマレイミドのような通例の防汚活性化合物である。

40

【0320】

使用する防汚組成物は、本発明の組成物の本発明の活性化合物を0．001～50重量％、特に0．01～20重量％の濃度で含んで成る。

【0321】

さらに本発明の防汚組成物は、例えば *Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732* および *Williams, 防汚用の船舶塗装 (Antifouling Marine Coating)*、ノイズ、パーク リッジ、1973に記載されているような通例の成分を含んで成る。

50

【0322】

本発明の殺藻性、殺菌・殺カビ性、殺軟体動物性の活性化合物および殺虫性の活性化合物の外に、防汚塗料は特に結合剤を含んで成る。

【0323】

知られている結合剤の例は、溶媒系中のポリビニルクロライド、溶媒系中の塩化ゴム、溶媒系中、特に水性系でのアクリル酸樹脂、水性分散物状態または有機溶媒系の状態の塩化ビニル／酢酸ビニルコポリマー系、ブタジエン／スチレン／アクリロニトリルゴム、亜麻仁油のような乾燥油、タールまたはビチューメンと組み合わせた樹脂エステルまたは修飾硬化樹脂、アスファルトおよびエポキシ化合物、少量の塩化ゴム、塩化ポリプロピレンおよびビニル樹脂である。

10

【0324】

適当ならば、塗料は好ましくは塩水に不溶性の無機顔料、有機顔料または着色剤も含んで成る。塗料はさらに、活性化合物の放出を制御するコロホニウムのような材料を含んで成る。さらに塗料は流動性に影響を及ぼす可塑剤、モディファイヤーおよび他の通例の成分を含んで成ることもできる。本発明の化合物または上記混合物は、自己研磨性 (self-polishing) の防汚系に包含することができる。

【0325】

活性化合物は、例えば住居、工場のホール、事務所、乗り物の部屋等のような閉ざされた空間に見られる動物有害生物、特に昆虫、蛛形類およびダニの防除にも適する。それらはこれらの有害生物を防除するために家庭用の殺虫剤製品中に単独で、または他の活性化合物および助剤と組み合わせて使用できる。それらは感受性および耐性種に対して、ならびにすべての生育段階に対して活性である。これらの有害生物には：

20

スコルピオニデア (Scorpionidea) 目から、例えばブ투스 オクシタンス (Buthus occitanus)。

【0326】

ダニ目 (Acarina) から、例えばアルガス ペルシカス (Argas persicus)、アルガス レフレクサス (Argas reflexus)、ブリオビア種 (Bryobia spp.)、ダルマニッサス ガリーナ (Dermanyssus gallinae)、グリシファガス ドメニスティカス (Glyciphagus domesticus)、オルニソドラス モウバット (Ornithodoros moubat)、リピセファラス サングイネウス (Rhipicephalus sanguineus)、トロンビクーラ アルフレッドウジェシィ (Trombicula alfreddugesi)、ノイトロンビクーラ オータムナリス (Neutrombicula autumnalis)、ダーマトファゴイデス プテロニッシムス (Dermatophagoides pteronissimus)、ダーマトファゴイデス ホリナ (Dermatophagoides forinae)。

30

【0327】

クモ目 (Araneae) から、例えばアビクラリーダ科 (Aviculariidae)、ゴネグモ科 (Araneidae)。

【0328】

ザトウムシ目 (Opiliones) から、例えばシュードスコルピオン チェリファー (Pseudoscorpiones chelifera)、シュードスコルピオン チェイリジウム (Pseudoscorpiones cheiridium)、オピリオンズ ファランギム (Opiliones phalangium)。

40

【0329】

等脚類 (Isopoda) から、例えばオニスカス アセルス (Oniscus asellus)、ポルセリオ スカバー (Porcellio scaber)。

【0330】

倍脚綱 (Diplopoda) から、例えばブラニウラス ギュタラタス (Blaniulus guttulatus)、ポリデススムス種 (Polydesmus spp.)。

50

【0331】

唇脚綱 (Chilopoda) から、例えばゲオフィラス種 (Geophilus spp.)。

【0332】

ザイгентーマ (Zygentoma) から、例えばシテノレピスマ種 (Ctenolepisma spp.)、レピスマ サッカリーナ (Lepisma saccharina)、レピスマデス インクイリニス (Lepismodes inquilinus)。

【0333】

網翅目 (Blattaria) から、例えばブラッテラ オリエンタリス (Blattaria orientalis)、ブラッテラ ゲルマニカ (Blattella germanica)、ブラッテラ アサヒナイ (Blattella asahinai)、ロウコファーエア マデラ (Leucophaea maderae)、パンクロラ種 (Panchlora spp.)、パルコブラッタ種 (Parcoblatta spp.)、ペリプラネータ オーストララシー (Periplaneta australasiae)、ペリプラネータ アメリカーナ (Periplaneta americana)、ペリプラネータ ブルンネア (Periplaneta brunnea)、ペリプラネータ フリギノサ (Periplaneta fuliginosa)、スぺーラ ロンギパルパ (Supella longipalpa)。

10

【0334】

跳躍目 (Saltatoria) から、例えばアケータ ドメスティカス (Acheta domesticus)。

20

【0335】

革翅目 (Dermaptera) から、例えばフォリフィクーラ オーリクラリア (Forficula auricularia)。

【0336】

等翅目 (Isoptera) から、例えばカロターメス種 (Kaloterмес spp.)、レティキュリターメス種 (Reticulitermes spp.)。

【0337】

チャタテムシ目 (Psocoptera) から、例えばレピナタス種 (Lepinatus spp.)、リポセリス種 (Liposcelis spp.)。

30

【0338】

コレプテラ目 (Coleoptera) から、例えばアントレナス種 (Anthrenus spp.)、アッタゲナス種 (Attagenus spp.)、ダルメステス種 (Dermostes spp.)、ラテチカス オリゼ (Latheticus oryzae)、ネクロビア種 (Necrobia spp.)、ピチナス種 (Ptinus spp.)、リゾペルサ ドミニカ (Rhizopertha dominica)、シトフィラス グラナリウス (Sitophilus granarius)、シトフィラス オリゼ (Sitophilus oryzae)、シトフィラス ゼアマイス (Sitophilus zeamais)、ステゴビウム パニセウム (Stegobium panicum)。

40

【0339】

双翅目 (Diptera) から、例えばアエデス エジプティ (Aedes aegypti)、アエデス アルボピクタス (Aedes albopictus)、アエデス テニオリンクス (Aedes taeniorhynchus)、アノフェラス種 (Anopheles spp.)、カリフォーラ エリトロセファーラ (Calliphora erythrocephala)、クリソゾーナ プルビアリス (Chrysosona pluvialis)、クレックス キンケファシアタス (Culex quinquefasciatus)、クレックス ピピエンス (Culex pipiens)、クレックス タルサリス (Culex tarsalis)、ドロソフィリア種 (Drosophila

50

a spp.)、ファンニア カニクラリス (*Fannia canicularis*)、ムスカ ドメスティカ (*Musca domestica*)、フェレボトムス種 (*Phlebotomus* spp.)、サルコファーガ カルナリア (*Sarcophaga carnaria*)、シムリウム種 (*Simulium* spp.)、ストモキシス カルシトランス (*Stomoxys calcitrans*)、チプューラ パルドーサ (*Tipula paludosa*)。

【0340】

鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えばアクロイア グリセーラ (*Achroia grisella*)、ガレリア メロネーラ (*Galleria mellonella*)、プロジア インターパンクテーラ (*Plodia interpunctella*)、チネア クロアセーラ (*Tinea cloacella*)、チネア ペリオネーラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ ビッセリエーラ (*Tineola bisselliella*)。

【0341】

微翅目 (*Siphonaptera*) から、例えばシテノセファリデス カニス (*Ctenocephalides canis*)、シテノセファリデス フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレックス イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシーラ チェオピス (*Xenopsylla cheopis*)。

【0342】

膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えばカンポノタス ヘリキュレヌス (*Camponotus herculeanus*)、ラシウス フリギノサス (*Lasius fuliginosus*)、ラシウス ニガー (*Lasius niger*)、ラシウス ウンブラタス (*Lasius umbratus*)、モノモリウム ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラベスプーラ種 (*Paravespula* spp.)、テトラモニウム ケスピタム (*Tetramorium caespitum*)。

【0343】

虱目 (*Anoplura*) から、例えばペディキュラス ヒューマナス カピチス (*Pediculus humanus capitis*)、ペディキュラス ヒューマナス コルポリス (*Pediculus humanus corporis*)、フィチラス プビス (*Phthirus pubis*)。

【0344】

異翅目 (*Heteroptera*) から、例えばシメックス ヘミプテラス (*Cimex hemipterus*)、シメックス レクツラリアス (*Cimex lectularius*)、ロードニウス プロリクス (*Rhodnius prolixus*)、トリアトマ インフェスタンス (*Triatoma infestans*)。

【0345】

それらは家庭用の殺虫剤分野で、それらは単独で、またはリン酸エステル、カルバメート、ピレスロイド、成長調節物質のような他の適当な活性化合物、または他の既知の種類の殺虫剤からの活性化合物と組み合わせて使用する。

【0346】

それらはエアゾール、圧力をかけない噴霧製品、例えばポンプおよびアトマイザーズプレー、自動化煙霧システム、煙霧器、フォーム、ゲル、セルローズまたはポリマーで作られたエバポレーター錠剤を含むエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲルおよび膜エバポレーター、噴射剤駆動エバポレーター、エネルギー無しの、または受動型の蒸発システム、防虫紙、防虫袋および防虫ゲル中で、粒剤または粉剤として、分散するための餌中 (*baits for spreading*) に、または餌場 (*bait station*) で使用される。

【0347】

本発明の製造および使用は、以下の実施例により具体的に説明する。

10

20

30

40

50

【0348】

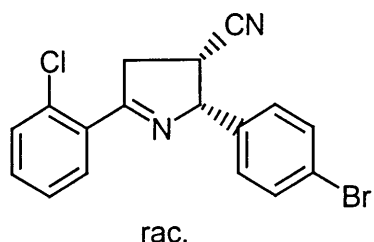
【実施例】

製造例

実施例 1

【0349】

【化64】



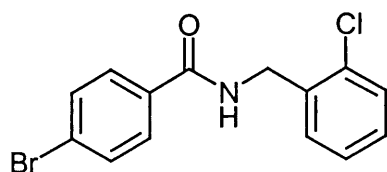
10

【0350】

合成工程 1 :

【0351】

【化65】



(VIII-b-1)

20

【0352】

攪拌しながら、63.5 g (0.50 モル) の塩化オキサリルの溶液 (50 ml のジクロロメタン中) を、100.5 g (0.50 モル) の4-ブロモ安息香酸、1 ml のジメチルホルムアミドおよび1200 ml のジクロロメタンの混合物に滴下する。4時間の攪拌後、そしていったんガス (HCl、CO、CO₂) の発生が止んだ後、混合物をアルゴン下で-60℃に冷却し、そして70.8 g (0.50 モル) の2-クロロベンジルアミンおよび161.0 g (1.25 モル) のN,N-ジイソプロピルエチルアミンの混合物を10分間にわたり滴下する。混合物を一晩攪拌し、そして生成した黄色い溶液を各々250 ml の2N 塩酸で3回、300 ml の水で1回、そして300 ml の飽和塩化ナトリウム溶液で1回、連続して洗浄する。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして蒸発乾固して残渣を得、これを室温で200 ml のジクロロメタンと攪拌し、そして次いで吸引濾過する。生じた残渣を200 ml のメチル tert-ブチルエーテルに溶解し、簡単に沸騰するまで加熱し、冷却し、そしてもう一度吸引濾過する。

30

【0353】

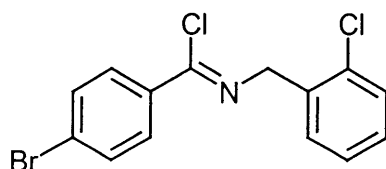
これにより融点が133℃の108 g (理論値の83%) の4-ブロモ-N-(2-クロロベンジル) ベンズアミドを得る。

40

合成工程 2 :

【0354】

【化66】



(II-b-1)

【0355】

50

106.4 g (0.34モル)の化合物(VIII-b-1)および200 mlの塩化チオニルの混合物を2時間、加熱還流する。室温に冷却した後、余分な塩化チオニルを減圧下で除去する。生成した黄色い油は室温で軽く静置すると結晶化する。

【0356】

これにより融点が58~61℃の112.5 g (理論値の97%)の4-ブロモ-N-(2-クロロベンジル)-フェニルカルボキシミドイルクロライドを得る。

合成工程3:

55.9 g (163ミリモル)の化合物(II-b-1)、17.3 g (327ミリモル)のアクリロニトリルおよび33.0 g (327ミリモル)のトリエチルアミンの混合物(300 mlのジクロロメタン中)を、光と空気を遮断して室温に7日間静置する。次いで混合物を100 mlの2N 塩酸で3回、100 mlの水で1回、そして100 mlの濃塩化ナトリウム溶液で1回洗浄する。混合物を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして次いで減圧下で蒸発乾固し、そして残渣はジクロロメタン/シクロヘキサンを使用してシリカゲルのクロマトグラフィーに繰り返しかける。

10

【0357】

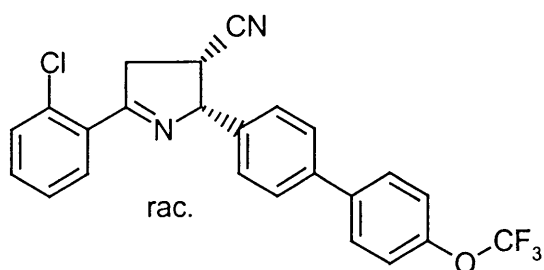
これにより融点が110℃の((2S, 3R), (2R, 3S))-2-(4-ブロモフェニル)-5-(2-クロロフェニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボニトリルを得る。

実施例2

【0358】

20

【化67】



30

【0359】

アルゴン下で、0.997 g (2.78ミリモル)の化合物(I-b-1)、0.606 g (2.90ミリモル)の4-トリフルオロメトキシフェニルboron酸、0.16 g (0.14ミリモル)のテトラキス-トリフェニルホスフィン-パラジウム、20 mlの1,2-ジメトキシエタンおよび5.0 mlの20パーセント濃度の炭酸ナトリウム溶液の混合物を、90℃で30分間加熱する。室温に冷却した後、混合物を30 mlの水および30 mlのメチル tert-ブチルエーテルに溶解する。有機相を分離し、そして水性相をメチル tert-ブチルエーテルで徹底的に抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして次いで減圧下で蒸発乾固する。ジクロロメタン/メチル tert-ブチルエーテルからの結晶化で白色固体を得る。

40

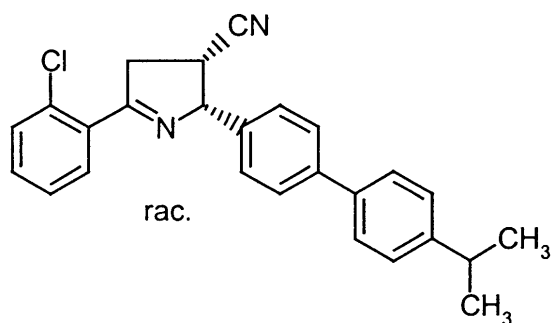
【0360】

これにより融点が132℃の320 mg (理論値の26%)の((2S, 3R), (2R, 3S))-5-(2-クロロフェニル)-2-[4'-(トリフルオロメトキシ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボニトリルを得る。

実施例3

【0361】

【化68】



10

【0362】

アルゴン下で、0.803 g (2.23ミリモル)の化合物(I-b-1)、0.732 g (4.46ミリモル)の4-イソプロピルフェニルboron酸、0.130 g (0.12ミリモル)のテトラキスートリフェニルホスフィンパラジウム、15 mlの1,2-ジメトキシエタンおよび3.7 mlの20パーセント濃度の炭酸ナトリウム溶液の混合物を、90℃で40分間加熱する。室温に冷却した後、混合物を30 mlの水および30 mlのメチル tert-ブチルエーテルに溶解する。有機相を分離し、そして水性相をメチル tert-ブチルエーテルで徹底的に抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして減圧下で蒸発乾固する。生成した残渣は移動相としてシクロヘキサン/酢酸エチルを使用したシリカゲルのクロマトグラフィーにかけて、所望の生成物を得る。

20

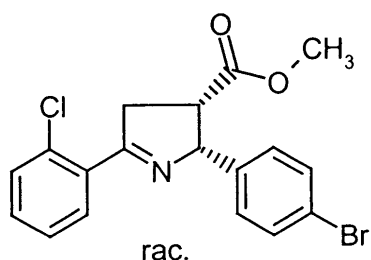
【0363】

これにより融点が127~128℃の230 mg (理論値の26%)の((2S, 3R), (2R, 3S))-5-(2-クロロフェニル)-2-[4'-(イソプロピル)-1,1'-ビフェニル-4-イル]-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボニトリルを得る。

実施例 4

【0364】

【化69】



30

【0365】

55.9 g (163ミリモル)の化合物(II-b-1)、28.1 g (327ミリモル)のメチルアクリレートおよび33.0 g (327ミリモル)のトリエチルアミンの混合物(300 mlのジクロロメタン中)を、光と空気を遮断して、室温に7日間静置する。次いで混合物を各100 mlの2N 塩酸で3回、100 mlの水で1回、そして100 mlの濃塩化ナトリウム溶液で1回洗浄する。混合物を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして次いで減圧下で蒸発乾固し、そして残渣はジクロロメタン/シクロヘキサンを使用してシリカゲルのクロマトグラフィーに繰り返しかける。

40

【0366】

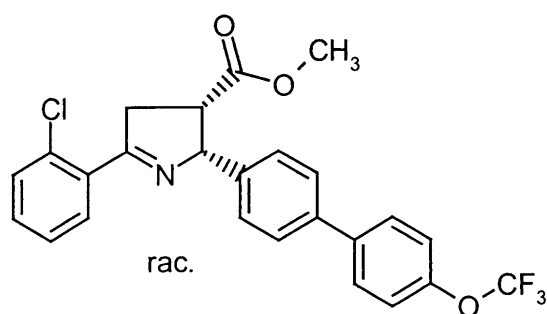
これにより融点が134℃の((2S, 3R), (2R, 3S))-2-(4-ブロモフェニル)-5-(2-クロロフェニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボキシレートを得る。

実施例 5

50

【0367】

【化70】



10

【0368】

アルゴン下で、1.09 g (2.78ミリモル)の化合物(I-b-2)、0.606 g (2.90ミリモル)の4-トリフルオロメトキシフェニルboron酸、0.16 g (0.14ミリモル)のテトラキス-トリフェニルホスフィン-パラジウム、20 mlの1,2-ジメトキシエタンおよび5.0 mlの20パーセント濃度の炭酸ナトリウム溶液の混合物を、90℃で30分間加熱する。室温に冷却した後、混合物を30 mlの水および30 mlのメチル tert-ブチルエーテルに溶解する。有機相を分離し、そして水性相をメチル tert-ブチルエーテルで徹底的に抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして次いで減圧下で蒸発乾固する。残渣は移動相としてシクロヘキサン/酢酸エチルを使用したシリカゲルのクロマトグラフィーにかける。

20

【0369】

これにより620 mg (理論値の47%)のメチル((2S, 3R), (2R, 3S))-5-(2-クロロフェニル)-2-[4'-(トリフルオロメトキシ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボキシレートを得る。

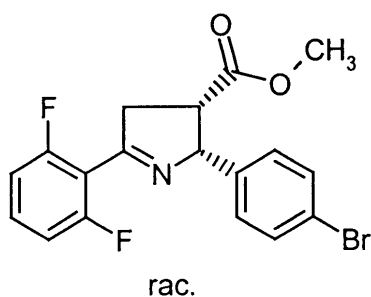
log P (pH 2.3) = 5.05.

実施例 6

【0370】

30

【化71】



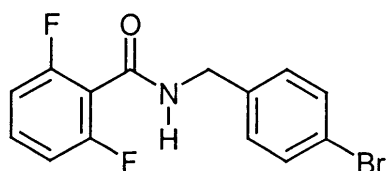
40

【0371】

合成工程 1:

【0372】

【化72】



(VIII-a-1)

50

【0373】

アルゴン下で、64.8 g (510ミリモル)の塩化オキサリルの溶液(200 mlのジクロロメタン中)を、20℃で73.3 g (464ミリモル)の2,6-ジフルオロ安息香酸の溶液(1000 mlのジクロロメタンおよび2 mlのジメチルホルムアミド中)に滴下する(1時間、アルゴン流無しで、内部温度は15℃に下がる)。ガス(CO₂、CO、HCl)の強力な発生が止んだ後、混合物を35℃に加熱し、そして5分間攪拌する。103.2 g (464ミリモル)の4-ブロモベンジルアミンヒドロクロライドを加え、そして0℃で140.5 g (1391ミリモル)のトリエチルアミンの溶液(100 mlのジクロロメタン中)を酸クロライドの溶液に滴下する。いったん反応が終わったら、200 mlのジクロロメタンを加える。混合物を各500 mlの2N HClで2回、各250 mlの2N NaOHで2回抽出し、そして次いで中性になるまで洗浄し、そして100 mlの濃塩化ナトリウム溶液で1回抽出する。混合物を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過し、そして濾液を減圧下で蒸発乾固する。所望の化合物はジクロロメタン/n-ヘキサンから結晶化する。

10

【0374】

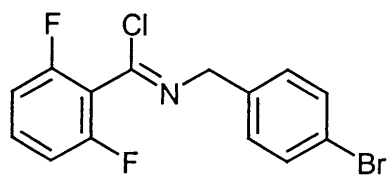
これにより融点が142℃の125.7 g (理論値の83%)のN-(4-ブロモベンジル)-2,6-ジフルオロベンズアミドを得る。

合成工程2:

【0375】

【化73】

20



(II-a-1)

【0376】

60 mlの塩化チオニル中の25 g (76.7ミリモル)の化合物(VIII-a-1)を2時間、加熱還流する。混合物を減圧下で蒸発乾固する。生成した残渣はさらに精製することなく次の反応に使用する。

30

合成工程3:

25.4 g (73.7ミリモル)の化合物(II-a-1)、25.3 gのメチルアクリレート(294ミリモル)および29.8 g (295ミリモル)のトリエチルアミンの混合物を、光と空気を遮断して、14日間静置する。

【0377】

後処理については、混合物を500 mlのジクロロメタンに溶解し、そして有機相を各500 mlの2N 塩酸で3回抽出する。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして次いで減圧下で濃縮し、そして生成した残渣は移動相としてジクロロメタン/メタノールを使用してシリカゲルのクロマトグラフィーに繰り返しかける。

【0378】

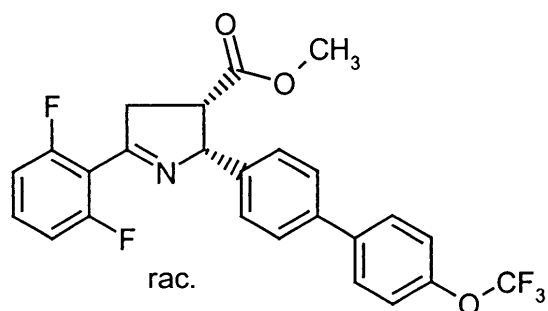
これにより融点が133℃のメチル((2S, 3R), (2R, 3S))-2-(4-ブロモフェニル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボキシレートを得る。

40

実施例7

【0379】

【化74】



10

【0380】

アルゴン下で、1.10 g (2.78ミリモル)の化合物(I-b-3)、0.606 g (2.90ミリモル)の4-トリフルオロメトキシフェニルboron酸、0.16 g (0.14ミリモル)のテトラキス-トリフェニルホスフィン-パラジウム、20 mlの1,2-ジメトキシエタンおよび5.0 mlの20パーセント濃度の炭酸ナトリウム溶液の混合物を、90℃で30分間加熱する。室温に冷却した後、混合物を30 mlの水および30 mlのメチル tert-ブチルエーテルに溶解する。有機相を分離し、そして水性相をメチル tert-ブチルエーテルで徹底的に抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして次いで蒸発乾固する。ジクロロメタン/メチル tert-ブチルエーテルからの結晶化で白色固体を得る。

20

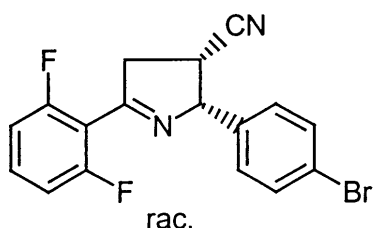
【0381】

これにより融点が125℃の480 mg (理論値の39%)のメチル((2S, 3R), (2R, 3S))-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-[4'-(トリフルオロメトキシ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボキシレートを得る。

実施例 8

【0382】

【化75】



30

【0383】

25.4 g (76.6ミリモル)の化合物(II-a-1)、16.2 g (303ミリモル)のアクリロニトリルおよび30.7 g (303ミリモル)のトリエチルアミンの混合物(300 mlのジクロロメタン中)を、光と空気を遮断して、室温に7日間静置する。次いで混合物を各100 mlの2N塩酸で3回、100 mlの水で1回、そして100 mlの濃塩化ナトリウム溶液で1回洗浄する。混合物を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして次いで減圧下で蒸発乾固し、そして残渣は移動相としてジクロロメタン/シクロヘキサンを使用してシリカゲルのクロマトグラフィーに繰り返しかける。

40

【0384】

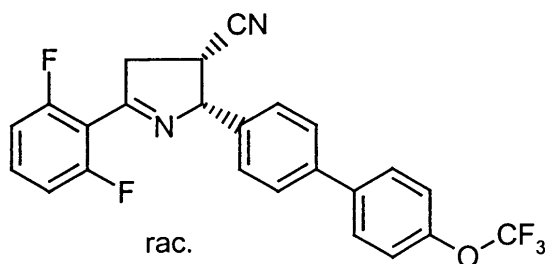
これにより融点が159℃の((2S, 3R), (2R, 3S))-2-(4-ブロモフェニル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボニトリルを得る。

実施例 9

【0385】

50

【化 7 6】



10

【0386】

アルゴン下で、1.00 g (2.78ミリモル)の化合物(I-b-4)、0.606 g (2.90ミリモル)の4-トリフルオロメトキシフェニルboron酸、0.16 g (0.14ミリモル)のテトラキス-トリフェニルホスフィンパラジウム、20 mlの1,2-ジメトキシエタンおよび5.0 mlの20パーセント濃度の炭酸ナトリウム溶液の混合物を、90℃で30分間加熱する。室温に冷却した後、混合物を30 mlの水および30 mlのメチル tert-ブチルエーテルに溶解する。有機相を分離し、そして水性相をメチル tert-ブチルエーテルを使用して徹底的に抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして次いで減圧下で蒸発乾固する。ジクロロメタン/メチル tert-ブチルエーテルからの結晶化で淡黄色の固体を得る。

20

【0387】

これにより融点が145℃の520 mg (理論値の42%)の((2S, 3R), (2R, 3S))-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-[4'-(トリフルオロメトキシ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-3-カルボニトリルを得る。

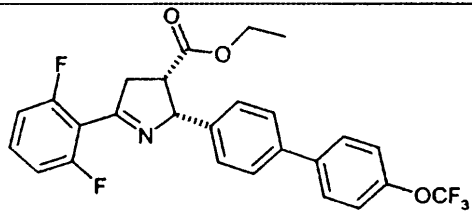
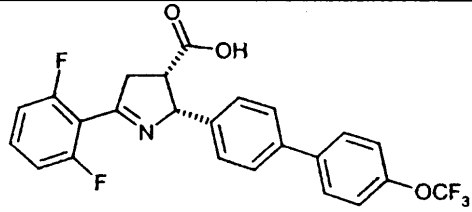
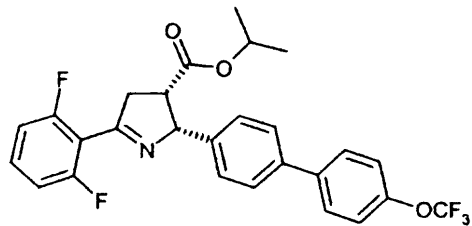
【0388】

以下の表に掲げる化合物は、上記の本発明による方法の1つに準じて製造することができる。

【0389】

【表1】

30

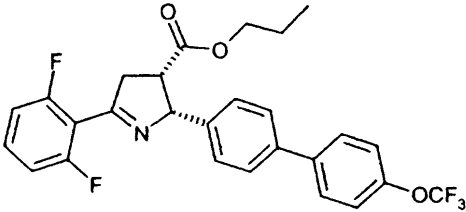
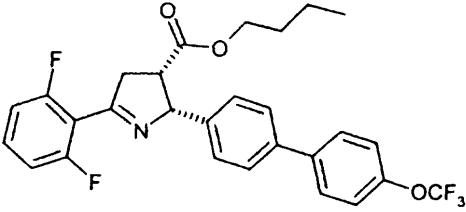
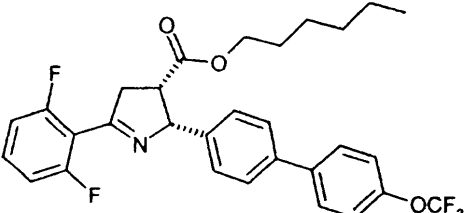
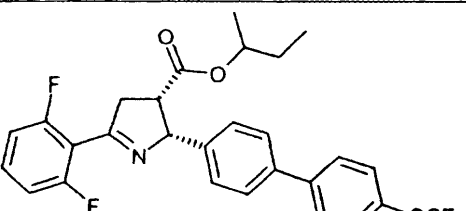
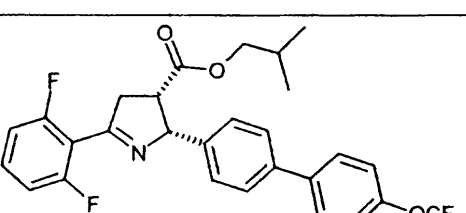
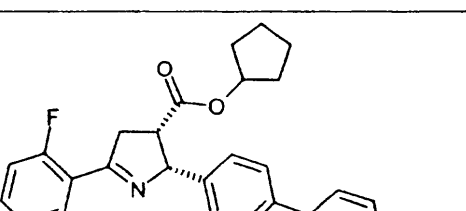
No.	構造	log P	融点/°C
10		4.73 ^{a)}	
11		3.35 ^{a)}	
12		5.05 ^{a)}	

10

20

【 0 3 9 0 】

【 表 2 】

No.	構造	log P	融点 /°C
13			
14		5.41a) 5.49b)	
15		6.11a) 6.18b)	
16		5.40a) 5.48b)	
17		5.38a) 5.47b)	
18		5.47a) 5.54b)	

10

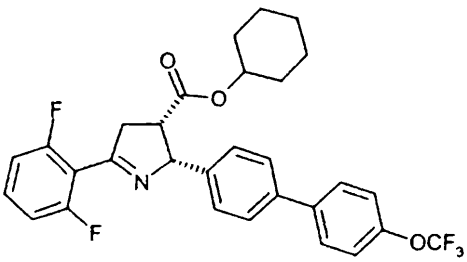
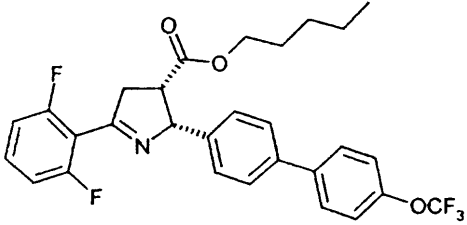
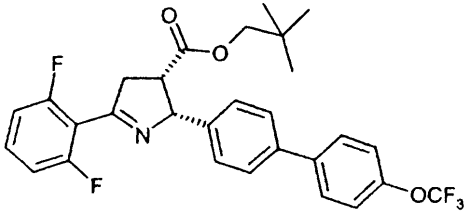
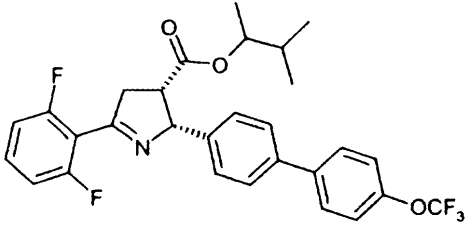
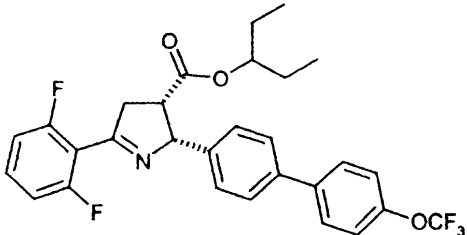
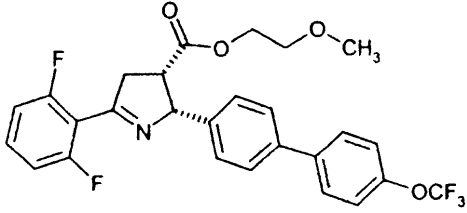
20

30

40

【0391】

【表3】

No.	構造	log P	融点/°C
19		5.85 ^{a)} 5.91 ^{b)}	
20		5.84 ^{a)}	
21		5.78 ^{a)}	
22		5.71 ^{a)}	
23		5.78 ^{a)}	
24		4.37 ^{a)}	

10

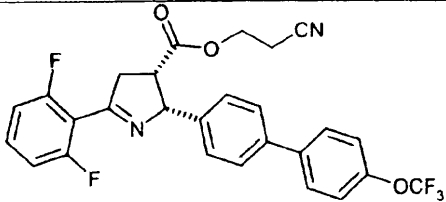
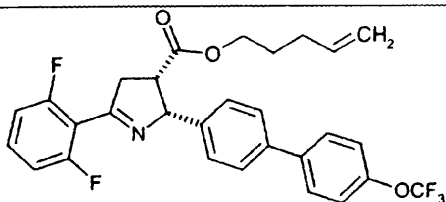
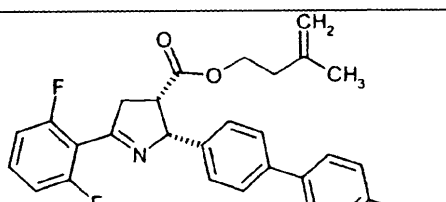
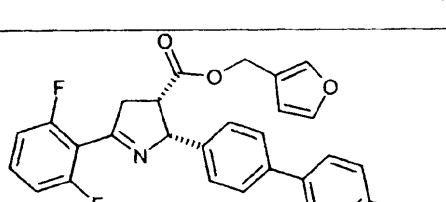
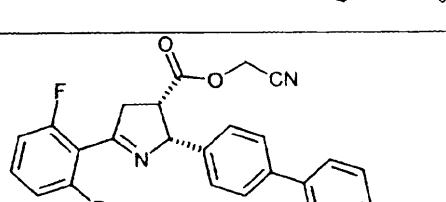
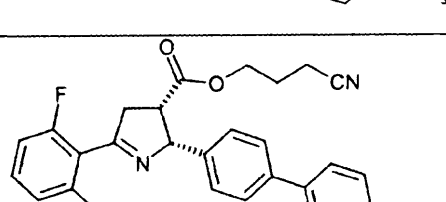
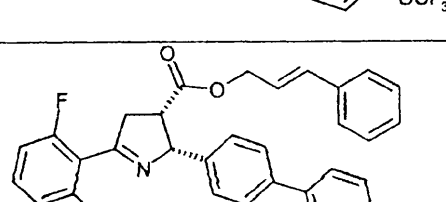
20

30

40

【0392】

【表4】

No.	構造	log P	融点/°C
25		4.08 ^{a)}	
26		5.48 ^{a)}	
27		5.48 ^{a)}	
28		4.87 ^{a)}	
29		4.23 ^{a)}	
30		4.18 ^{a)}	
31		5.55 ^{a)}	

10

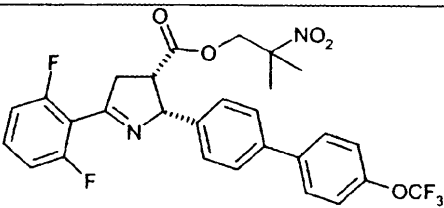
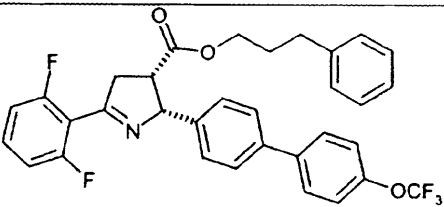
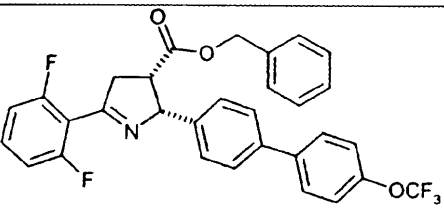
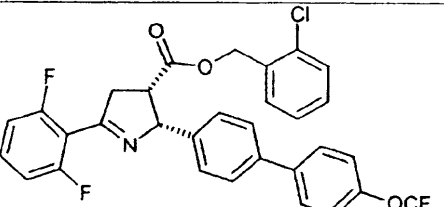
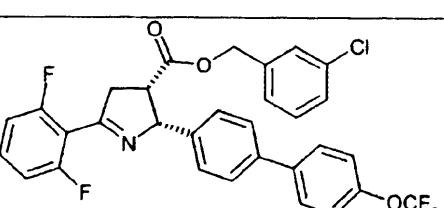
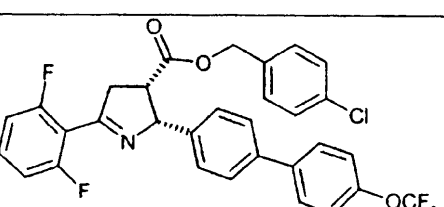
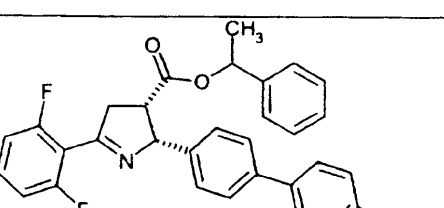
20

30

40

【0393】

【表5】

No.	構造	log P	融点/°C
32		4.77 ^{a)}	
33		5.78 ^{a)}	
34		5.31 ^{a)}	
35		5.65 ^{a)}	
36		5.58 ^{a)}	
37			
38		5.54 ^{a)}	

10

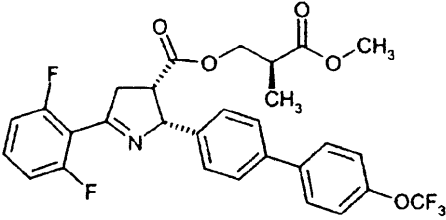
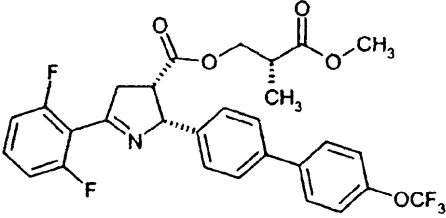
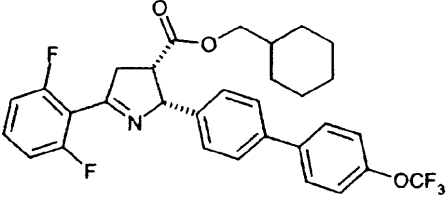
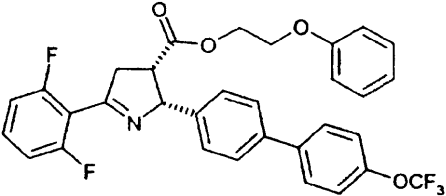
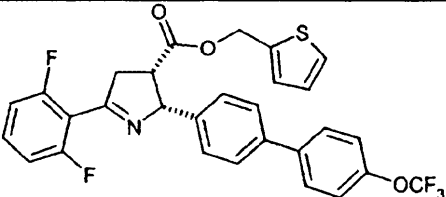
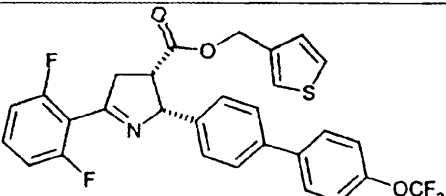
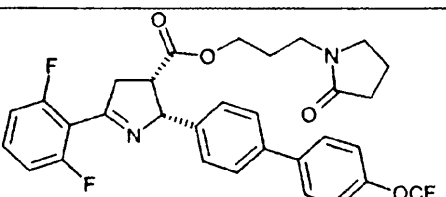
20

30

40

【 0 3 9 4 】

【 表 6 】

No.	構造	log P	融点/°C
39		4.67 ^{a)}	
40		4.67 ^{a)}	
41		6.28 ^{a)}	
42		5.21 ^{a)}	
43		5.19 ^{a)}	
44		5.14 ^{a)}	
45		3.72 ^{a)}	

10

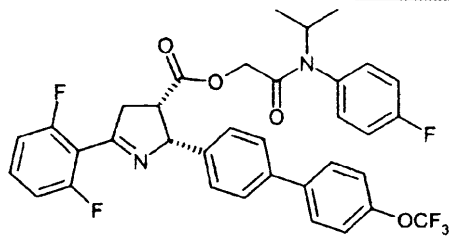
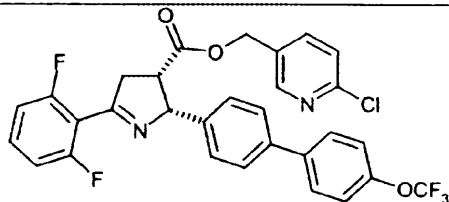
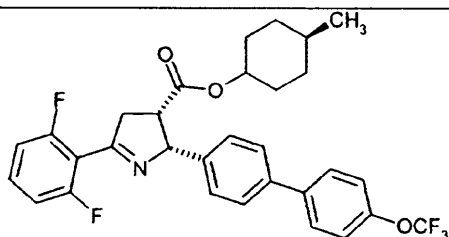
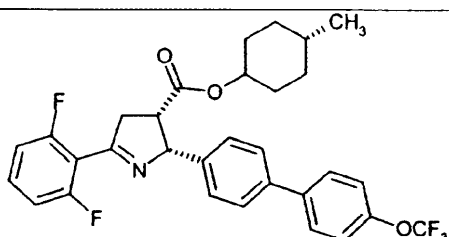
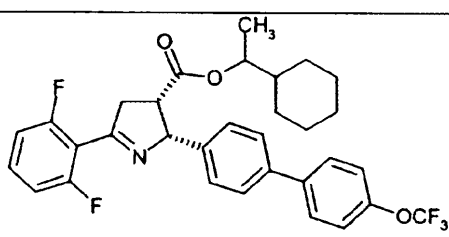
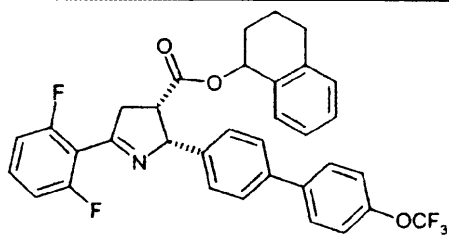
20

30

40

【0395】

【表7】

No.	構造	log P	融点/°C
46		4.98 ^{a)}	
47		4.82 ^{a)}	
48		6.22 ^{a)}	
49		6.28 ^{a)}	
50		6.54 ^{a)}	
51		5.97 ^{a)}	

10

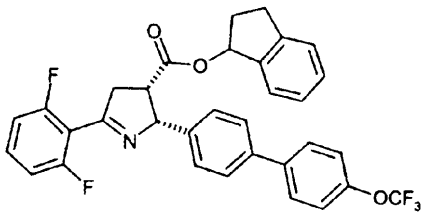
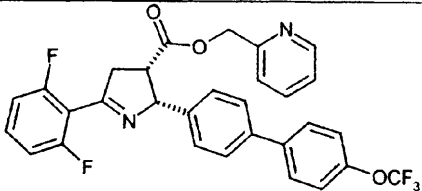
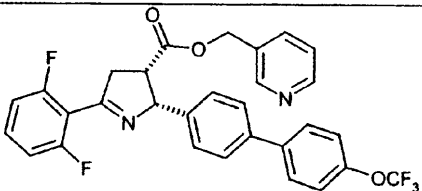
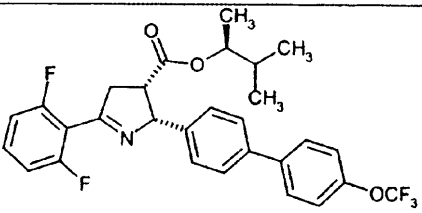
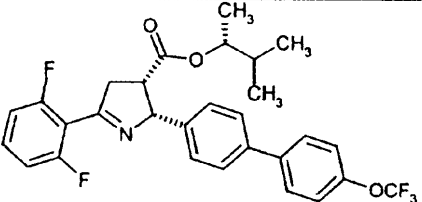
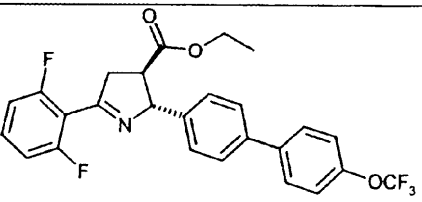
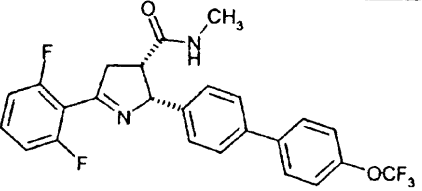
20

30

40

【0396】

【表8】

No.	構造	log P	融点/°C
52		5.71 ^{a)}	
53		4.13 ^{a)}	
54		3.59 ^{a)}	
55		5.74 ^{a)} 5.77 ^{b)}	
56		5.65 ^{a)} 5.68 ^{b)}	
57			
58		3.26 ^{a)}	

10

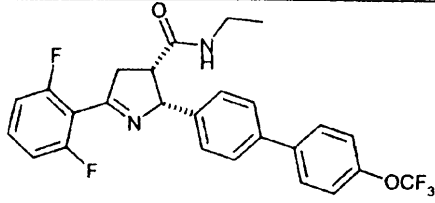
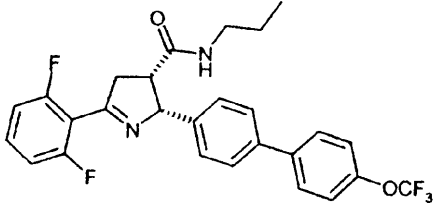
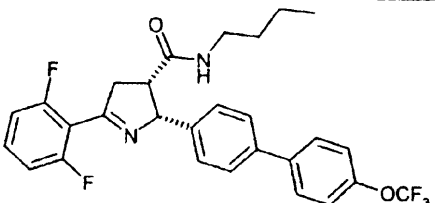
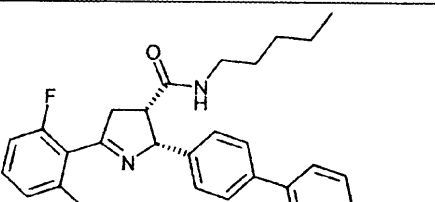
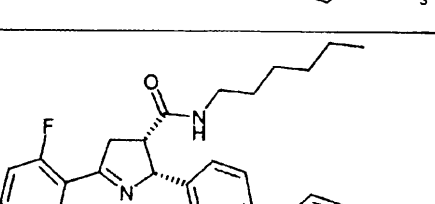
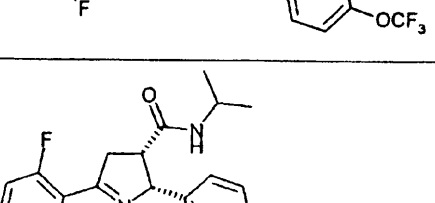
20

30

40

【0397】

【表9】

No.	構造	log P	融点/°C
59		3.49 ^{a)}	
60		3.78 ^{a)}	
61		4.03 ^{a)}	
62		4.37 ^{a)}	
63		4.67 ^{a)}	
64		3.74 ^{a)}	

10

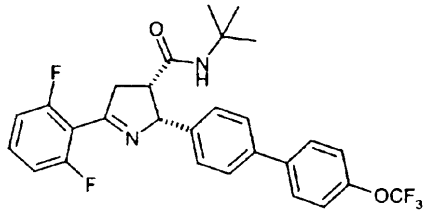
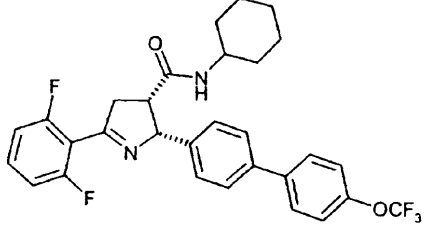
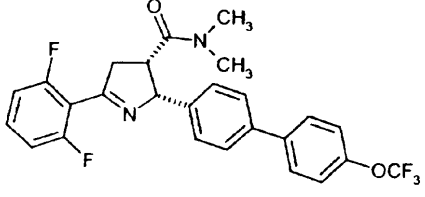
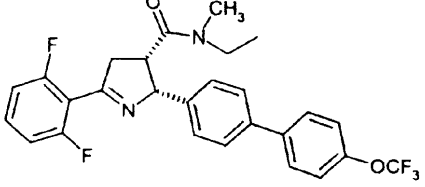
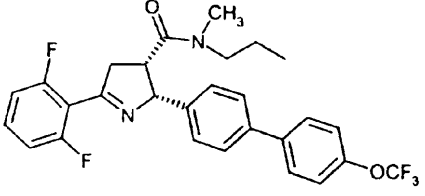
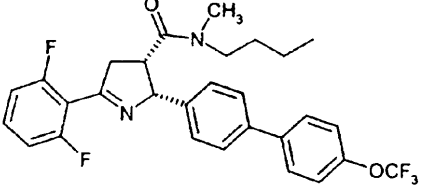
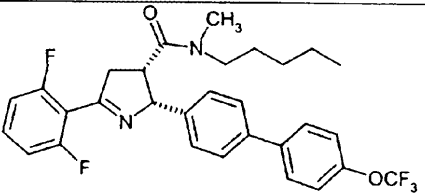
20

30

40

【0398】

【表10】

No.	構造	log P	融点/°C
65		4.23 ^{a)}	
66		4.37 ^{a)}	
67		3.61 ^{a)}	
68		3.90 ^{a)}	
69		4.23 ^{a)}	
70		4.56 ^{a)}	
71		4.92 ^{a)}	

10

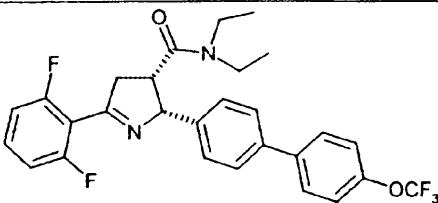
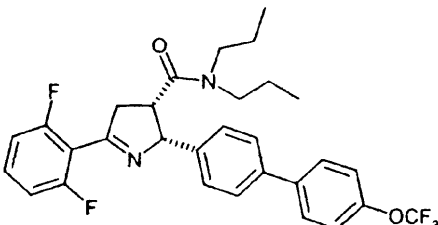
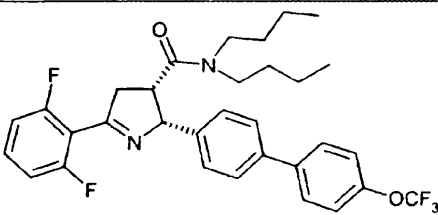
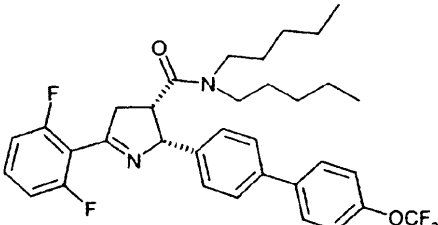
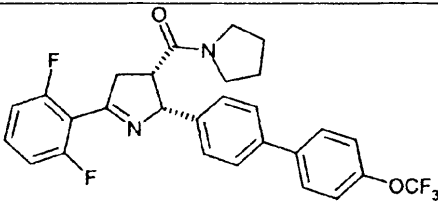
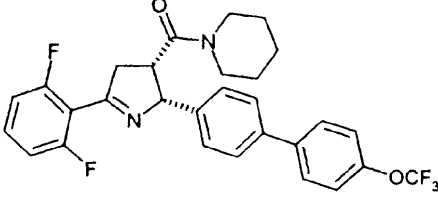
20

30

40

【0399】

【表11】

No.	構造	log P	融点/°C
72		4.18 ^{a)}	
73		4.92 ^{a)}	
74		5.65 ^{a)}	
75		6.43 ^{a)}	
76		3.82 ^{a)}	
77		4.32 ^{a)}	

10

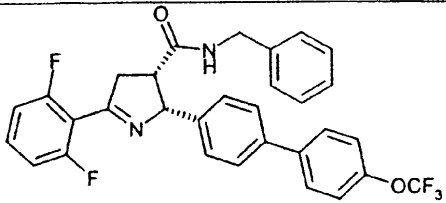
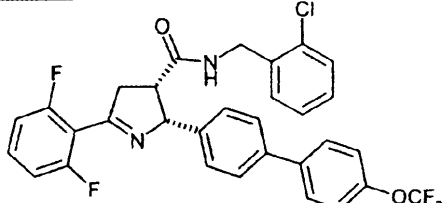
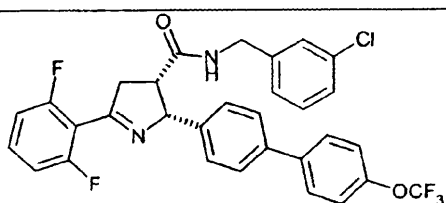
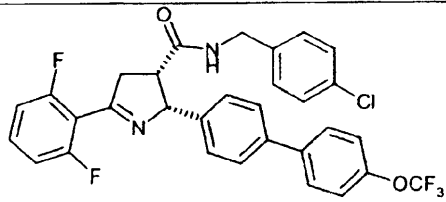
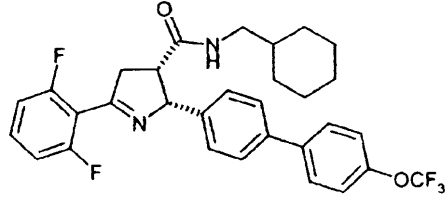
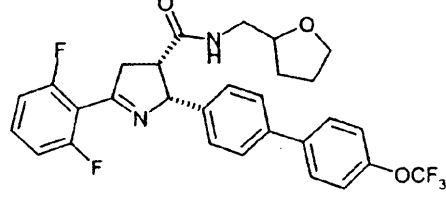
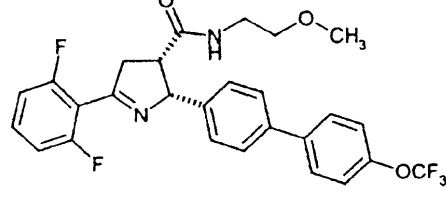
20

30

40

【0400】

【表12】

No.	構造	log P	融点/°C
78		3.94 ^{a)}	
79		4.46 ^{a)}	
80		4.46 ^{a)}	
81		4.41 ^{a)}	
82		4.67 ^{a)}	
83		3.49 ^{a)}	
84		3.33 ^{a)}	

10

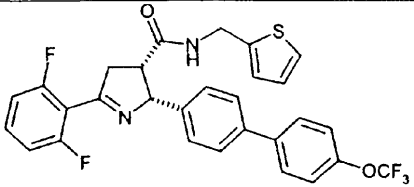
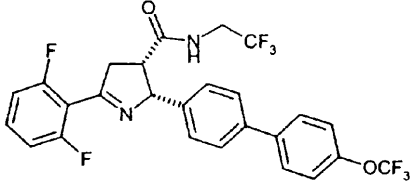
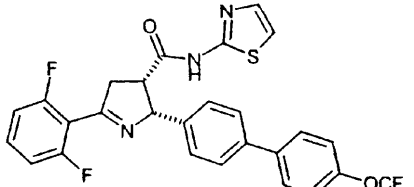
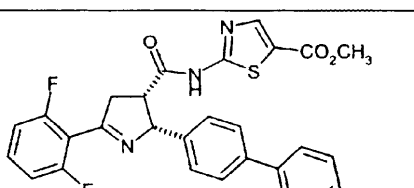
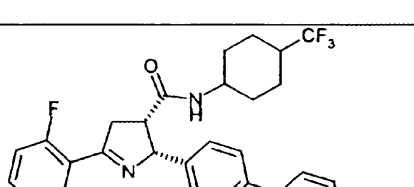
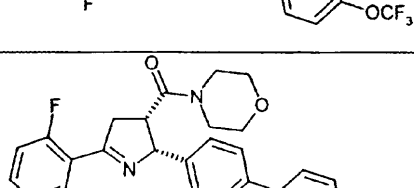
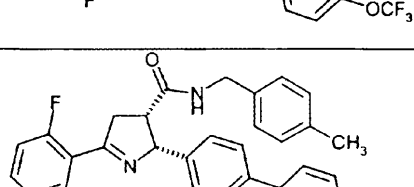
20

30

40

【 0 4 0 1 】

【 表 1 3 】

No.	構造	log P	融点/°C
85		4.03 ^{a)}	
86		3.94 ^{a)}	
87		3.78 ^{a)}	
88		3.94 ^{a)}	
89		4.46 ^{a)}	
90		3.49 ^{a)}	
91		4.37 ^{a)}	

10

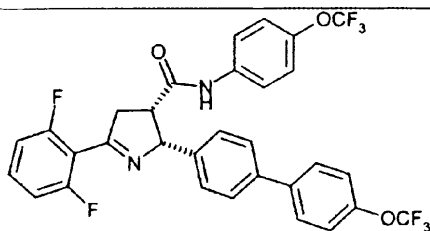
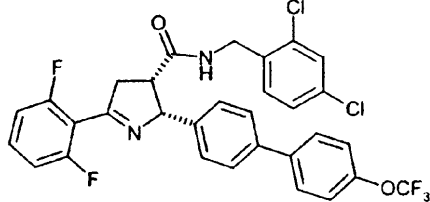
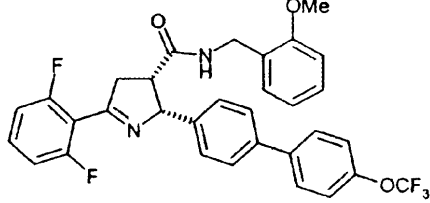
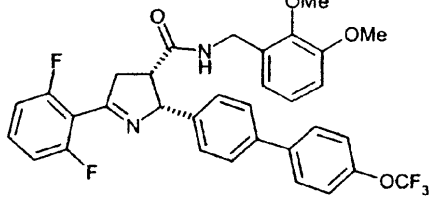
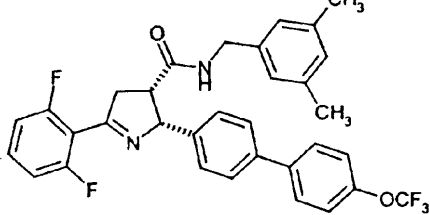
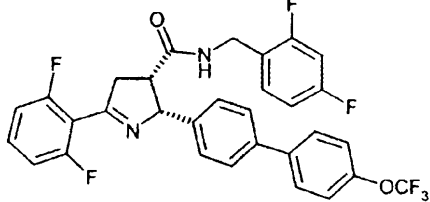
20

30

40

【0402】

【表14】

No.	構造	log P	融点/°C
92		4.87 ^{a)}	
93		4.87 ^{a)}	
94		4.18 ^{a)}	
95		4.03 ^{a)}	
96		4.72 ^{a)}	
97		4.23 ^{a)}	

10

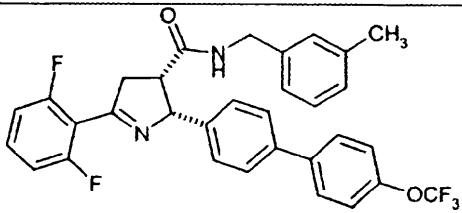
20

30

40

【 0 4 0 3 】

【 表 1 5 】

No.	構造	log P	融点/°C
98		4.41 ^{a)}	

10

【0404】

上記の表および製造例に与える log P 値は、逆相カラム (C18) を使用した HPLC (高性能液体クロマトグラフィー) により EEC 指示 79/831 Annex V. A8 を用いて測定する。温度: 43°C

酸性範囲でこの測定は、移動相として 0.1% 水性リン酸およびアセトニトリル; 10% アセトニトリルから 90% アセトニトリルへの直線勾配を使用して pH 2.3 で行う (表では ^{a)} と記す)。

【0405】

中性範囲でこの測定は、移動相として 0.01 モルのリン酸緩衝水溶液およびアセトニトリル; 10% アセトニトリルから 90% アセトニトリルへの直線勾配を使用して pH 7.5 で行う (表では ^{b)} と記す)。

20

【0406】

カリブレーションは、既知の P 値 (2つの連続するアルカノン間の直線内挿法を使用した保持時間による log P 値の決定) を用いて非分枝アルカン-2-オン (3~16 個の炭素原子を有する) を使用して行う。

【0407】

ラムダ最大値は、200 nm から 400 nm の UV スペクトルを使用したクロマトグラフィーシグナルの最大値で決定した。

【0408】

使用例

30

実施例 A

ハモグリバエ (*Liriomyza*) 試験

溶媒: 3 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤: 1 重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1 重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物は乳化剤を含む水で望ましい濃度に希釈する。

【0409】

卵および発育段階のアザミウマ (マメハモグリバエ: *Liriomyza trifolii*) に侵襲されたインゲン (*Phaseolus vulgaris*) 植物を、所望の濃度の活性化合物の調製物に浸す。

40

【0410】

所望の期間後、効果を % で決定する。100% とはすべてのアザミウマが殺されたことを意味し; 0% はアザミウマが全く殺されなかったことを意味する。

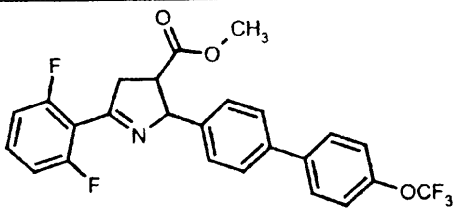
【0411】

活性化合物、活性化合物濃度および試験結果は以下の表に示す。

【0412】

【表 16】

表A：ハモグリバエ(Liriomyza)試験

活性化合物	ppmでの活性化合物濃度	7日後の死亡率%
	1000	100

10

【0413】

実施例 B

ネコブセンチュウ (Meloidogyne) 試験

溶媒：30重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物は乳化剤を含有する水で望ましい濃度に希釈する。

20

【0414】

容器に砂、活性化合物の溶液、サツマイモネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita) の卵／幼虫懸濁液およびレタスの種子を満たす。レタスの種子は発芽し、そして植物が生育する。根にはえい瘤が形成される。

【0415】

所望の期間の後、殺線虫活性はえい瘤形成により%で決定する。100%とは、えい瘤が形成されなかったことを意味し；0%は未処置対照の数に対応する処理した植物におけるえい瘤の数を意味する。

【0416】

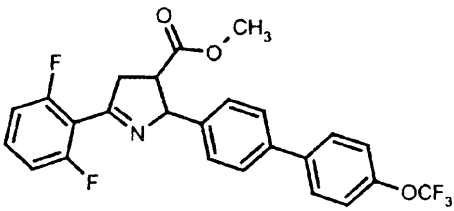
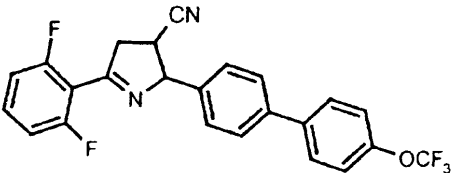
活性化合物、活性化合物濃度および試験結果は以下の表に示す。

30

【0417】

【表17】

表B：ネコフセンチュウ(Meloidogyne)試験

活性化合物	ppmでの活性化合物濃度	14日後の 死亡率%
	20	100
	20	90

10

【0418】

20

実施例：C

ハムシ (Phaedon) の幼虫試験

溶媒：30重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物は乳化剤を含む水で望ましい濃度に希釈する。

【0419】

キャベツの葉 (Brassica oleracea) を、所望の濃度の活性化合物の調製物に浸漬することにより処理し、そしてハムシ (mustard beetle) (Phaedon cochleariae) の幼虫を葉が湿っている間に群がらせる。

30

【0420】

所望の期間の後、死亡を%で決定する。100%とは、すべての甲虫の幼虫が殺されたことを意味し；0%は甲虫の幼虫が全く殺されなかったことを意味する。

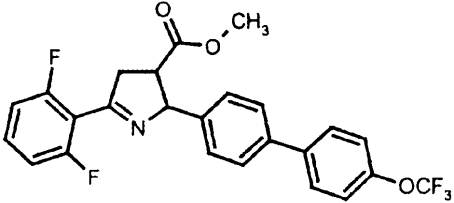
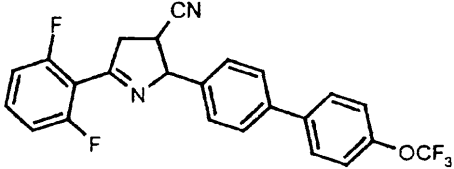
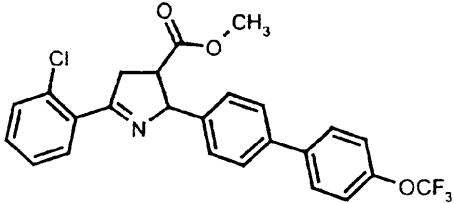
【0421】

活性化合物、活性化合物濃度および試験結果は以下の表に示す。

【0422】

【表18】

表C：ハムシ(Phaedon)の幼虫試験

活性化合物	ppmでの活性化合物濃度	7日後の死亡率%
	1000	100
	1000	100
	1000	100

10

20

【0423】

実施例：D

シロヤナガ (*Spodoptera frugiperda*) 試験

溶媒：30重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物は乳化剤を含有する水で望ましい濃度に希釈する。

30

【0424】

キャベツの葉 (*Brassica oleracea*) を、所望の濃度の活性化合物の調製物に浸漬することにより処理し、そしてシロヤナガ (*Spodoptera frugiperda*) の幼虫を葉が湿っている間に群がらせる。

【0425】

所望の期間の後、死亡を%で決定する。100%とは、すべての幼虫が殺されたことを意味し；0%は幼虫が全く殺されなかったことを意味する。

【0426】

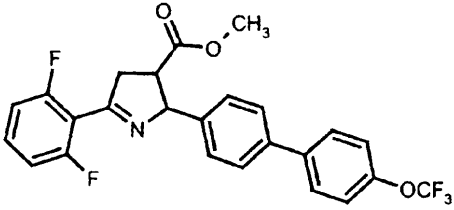
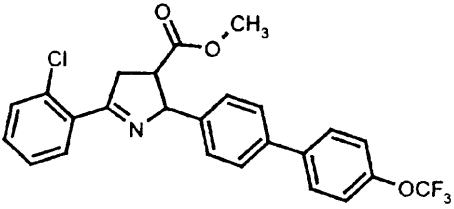
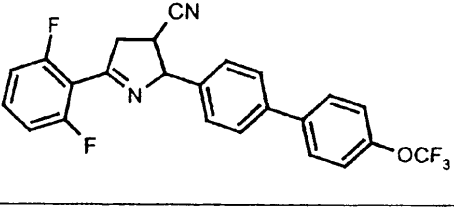
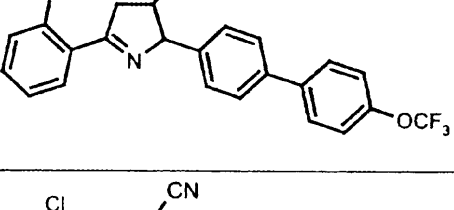
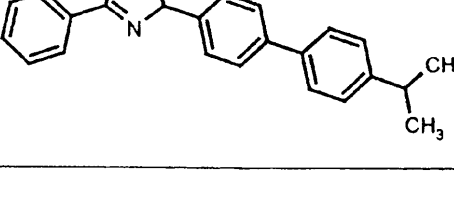
活性化合物、活性化合物濃度および試験結果は以下の表に示す。

40

【0427】

【表19】

表D：シロヤナガ(*Spodoptera frugiperda*)試験

活性化合物	ppmでの活性化合物濃度	7日後の 死亡率%
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100

10

20

30

【0428】

実施例 E

ジアブロティカ バルテータ (*Diabrotica balteata*) 試験 (土壤中の 40
幼虫)

臨界濃度試験／土壤昆虫ートランスジェニック植物の処理

溶媒：7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混
合し、上記量の乳化剤を加え、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

【0429】

活性化合物の調製物を土壤に注ぐ。ここで調製物中の活性化合物の濃度はほとんど無関係
であり、ppm (mg/l) で示す単位容量の土壤あたりの活性化合物の重量による量の
みが問題である。土壤を0, 25リットルのポットに満たし、そしてこれらを20℃で静 50

置する。

【0430】

準備直後に、栽培変種 YIELD GUARD (米国のモンサント社 (Monsanto Comp.) の登録商標) の5つの発芽前のトウモロコシ球茎を各ポットに植える。2日後、問題の試験昆虫を処理した土壤に置く。さらに7日後、活性化合物の効力を発芽したトウモロコシ植物を計数することにより測定する (1植物 = 20% 効力)。

実施例 F

オオタバコガ (Heliothis virescens) 試験 (トランスジェニック植物の処理)

溶媒: 7重量部のジメチルホルムアミド

10

乳化剤: 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および上記量の乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

【0431】

栽培変種 Roundup Ready (米国のモンサント社 (Monsanto Comp.) の登録商標) のダイズの苗条件 (Glycine max) を、所望の濃度の活性化合物の調製物に浸漬することにより処理し、そしてオオタバコガ (Heliothis virescens) を葉が湿っている間に群がらせる。

【0432】

所望の期間の後、死亡を%で決定する。100%とは、すべての幼虫が殺されたことを意味し; 0%は幼虫が全く殺されなかったことを意味する。

20

【国際公開パンフレット】

(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
28. März 2002 (28.03.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/24646 A1

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 207/22,
207/26, 409/14, 401/14, 405/14, 417/14, A01N 43/36

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

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/10422

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ,
LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN,
MW, MX, MZ, NO, NZ, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG,
SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN,
YU, ZA, ZW.

(22) Internationales Anmeldedatum:
10. September 2001 (10.09.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 47 116.1 22. September 2000 (22.09.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE];
51368 Leverkusen (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): JANSSEN, Jo-
hannes-Rudolf [DE/DE]; Knipprathstr. 47, 40789
Monheim (DE). PLANT, Andrew [GB/GB]; 1, Meadow
View, Wineresh, Berkshire RG 41/5PD (GB). ALIG,
Berad [DE/DE]; Im Rothsiefen 7, 53639 Königswinter
(DE). KRAATZ, Udo [DE/DE]; Andreasstr. 22a, 51375
Leverkusen (DE). THIELKING, Gerhard [DE/DE];
Kastanienallee 13, 51399 Burscheid (DE). ERDELEN,
Christoph [DE/DE]; Unterbüschhof 15, 42799 Leichlin-
gen (DE). TURBERG, Andreas [DE/DE]; Sinterstr. 86,
42781 Haan (DE). HANSEN, Olaf [DE/DE]; Tannenweg
43, 40764 Langenfeld (DE).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen
- insgesamt in elektronischer Form (mit Ausnahme des Kopf-
bogens); auf Antrag vom Internationalen Büro erhältlich

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



WO 02/24646 A1

(54) Title: DELTA1-PYRROLINES USED AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: DELTA1-PYRROLINE ALS PESTIZIDE

(57) Abstract: The invention relates to novel Δ^1 -pyrrolines of formula (I), wherein Ar¹, Ar² and Q have the meanings given in the
description, to several methods for producing these substances and to their use for controlling pests.

(57) Zusammenfassung: Neue Δ^1 -Pyrroline der Formel (I) in welcher Ar¹, Ar² und Q die in der Beschreibung angegebenen
Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von Schädlingen.

WO 02/24646

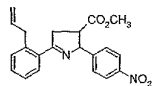
PCT/EP01/10422

DELTA1-PYRROLINE ALS PESTIZIDE

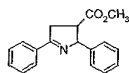
Die vorliegende Erfindung betrifft neue Δ^1 -Pyrroline, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

5

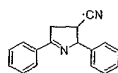
Bisher sind nur wenige 4-substituierte-2,5-bis-Aryl- Δ^1 -Pyrroline bekannt geworden:



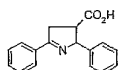
A. Padwa and A. Ku,
J. Am. Chem. Soc. 1978, 100, 2181



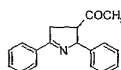
A. Padwa and J. Smolanoff,
J. Am. Chem. Soc. 1971, 93, 548



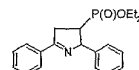
A. Padwa et al.,
J. Am. Chem. Soc. 1973, 95, 1945



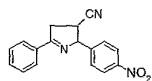
R. Huisgen et al.,
Chem. Ber. 1970, 103, 2368



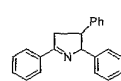
O. Tsuge et al.,
Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, 60, 3347



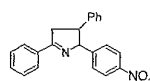
Gakis, N. et al., Helv. Chim.
Acta 1976, 68, 748



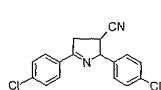
R. Huisgen et al.,
Chem. Ber. 1972, 105, 1258



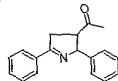
Padwa et al., Tet. Lett.
1972, 4087



Huisgen et al., Tet. Lett.
1966, 3603



A. R. Katritzky et al.,
Synthesis 1991, 10, 863



O. Tsuge, Bull. Chem. Soc. Jpn.
1987, 60, 3347

10

Über deren Eignung zur Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel ist nichts bekannt.

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

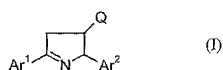
- 2 -

In WO 00/21958, WO 99/59968, WO 99/59967 und WO 98/22438 wurden andere Δ^1 -Pyrroline und deren Eignung als Schädlingsbekämpfungsmittel beschrieben.

Die Wirkungshöhe und/oder Wirkungsdauer dieser vorbekannten Verbindungen ist jedoch, insbesondere gegen bestimmte Organismen und/oder bei niedrigen Anwendungskonzentrationen, nicht in allen Anwendungsgebieten völlig zufriedenstellend.

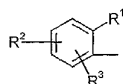
Wegen der vielfältigen Anforderungen an moderne Schädlingsbekämpfungsmittel, beispielsweise bezüglich Wirkhöhe, Wirkdauer, Wirkspektrum, Anwendungspektrum, Toxizität, Kombination mit anderen Wirkstoffen, Kombination mit Formulierungshilfsmitteln oder die Synthese, und wegen des möglichen Auftretens von Resistenzen kann die Entwicklung solcher Stoffe jedoch nie als abgeschlossen betrachtet werden, und es besteht beständig ein hoher Bedarf an neuen Verbindungen, die zumindest in Teilaspekten Vorteile gegenüber den bekannten Verbindungen besitzen.

Es wurden nun neue Δ^1 -Pyrroline der Formel (I)



gefunden, in welcher

Ar¹ für den Rest



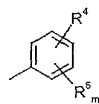
steht und

Ar² für den Rest

WO 02/24646

- 3 -

PCT/EP01/10422



steht, in denen

- m für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,
- 5 R¹ für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸ steht,
- R² und R³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl,
- 10 Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸ stehen,
- R⁴ für Halogen oder eine der folgenden Gruppierungen
- (l) -X-A
- 15 (m) -B-Z-D
- (n) -Y-E
- steht,
- R⁵ für Halogen, Hydroxy, Cyano, -CONH₂, -CSNH₂, Nitro, Alkyl, Alkylcarbo-
- 20 nyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Trialkylsilyl, Alkoxy-carbonyl, -CONR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶, Halogenalkylaminosulfonyl, Bisalkoxyboran, -B(OH)₂ steht,
- X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)₀, -NR⁶, Carbonyl, Carbonyloxy,
- 25 Oxy-carbonyl, Oxy-sulfonyl (OSO₂), Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylen-oxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen steht,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 4 -

- 5 A für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der Liste W² substituiertes 5-bis 10-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit einem oder mehreren Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 10 B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes p-Phenylen steht,
- Z für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff oder $-S(O)_q-$ steht,
- 15 D für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,
- Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxy-carbonyl, Alkyliden, Alkenylen, Alkinylen, Alkylendioxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Halogenalkylen, Halogenalkenylen steht,
- 20 E für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,
- W¹ für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkyl-carbonyl, Alkoxy-carbonyl, Pentafluorothio, $-S(O)_qR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,
- 25 W² für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkyl-carbonyl, Alkoxy-carbonyl, $-S(O)_qR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,
- 30

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 5 -

- n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,
- Q für $-\text{CO}_2\text{R}^9$, $-\text{COR}^{10}$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, $-\text{CN}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CSNH}_2$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$,
 5 $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{PO}(\text{OR}^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- Q außerdem für $-\text{CO}_2\text{R}^{13}$ oder $-\text{CONR}^{14}\text{R}^{15}$ steht,
- 10 o für 0, 1 oder 2 steht,
- R^6 für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,
- R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,
 15
- R^9 für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Aralkyl, Phenyl steht,
- R^{10} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl steht,
 20
- R^{11} für Alkyl, Aryl steht,
- R^{12} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl oder Aryl steht,
- 25 R^{13} für Wasserstoff; für einfach oder mehrfach substituiertes Alkyl; für gegebenenfalls substituiertes Aminocarbonylalkyl; für Alkenyl, Phenylalkenyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl oder Phenoxyalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl; für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1
 30 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl steht,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 6 -

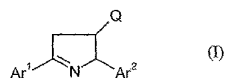
R¹⁴ und R¹⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogenalkyl, Alkoxyalkyl;
 für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenylalkyl; für jeweils
 gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl; für jeweils
 gegebenenfalls substituiertes, jeweils gesättigtes oder ungesättigtes Hetero-
 cyclyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe
 Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel stehen,

R¹⁴ und R¹⁵ außerdem gemeinsam für Alkylenoxyalkylen oder Alkylenthioalkylen
 stehen.

Die Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls in Abhängigkeit von der
 Art und Anzahl der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere bzw.
 Regioisomere oder deren Isomerengemische in unterschiedlicher Zusammensetzung
 vorliegen. Sowohl die reinen Isomere als auch die Isomerengemische werden erfin-
 dungsgemäß beansprucht.

Weiterhin wurde gefunden, dass man die neuen Verbindungen der Formel (I) nach
 einem der im folgenden beschriebenen Verfahren erhalten kann.

Δ^1 -Pyrroline der Formel (I)



in welcher

Ar¹, Ar², und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

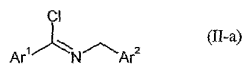
lassen sich herstellen,

A-1.) indem man Iminochloride der Formel (II-a)

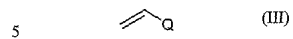
WO 02/24646

- 7 -

PCT/EP01/10422



mit Dipolarophilen der Formel (III)



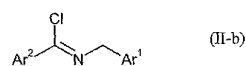
in welchen

Ar¹, Ar², und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

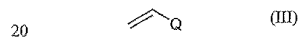
10

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

15 A-2.) indem man Iminochloride der Formel (II-b)



mit Dipolarophilen der Formel (III)



in welchen

Ar¹, Ar², und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

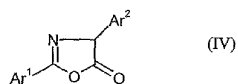
in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

WO 02/24646

- 8 -

PCT/EP01/10422

B.) indem man Oxazolinone der Formel (IV)



5 mit Dipolarophilen der Formel (III)

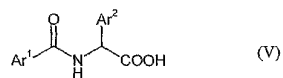


10 in welchen

Ar¹, Ar² und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

15 C.) indem man Carbonsäuren der Formel (V)



20 mit Dipolarophilen der Formel (III)



in welchen

25 Ar¹, Ar² und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

WO 02/24646

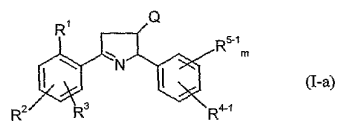
PCT/EP01/10422

- 9 -

in Gegenwart von Essigsäureanhydrid und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

D.) Δ^1 -Pyrroline der Formel (I-a)

5



in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , Q und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

R^{4-1} für A oder B-Z-D

steht, wobei

15

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

R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, $-\text{OSO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{S}(\text{O})_o\text{R}^6$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NHCO}_2\text{R}^6$, Haloalkylamino-sulfonyl steht,

20

wobei

R^6 , R^7 , R^8 und o die oben angegebenen Bedeutungen haben,

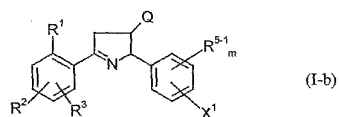
25

lassen sich herstellen, indem man Verbindungen der Formel (I-b)

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 10 -



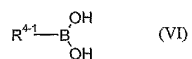
in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^{5-1} , Q und m die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5

X^1 für Cl, Br, I, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ steht

mit Boronsäuren der Formel (VI)



10

in welcher

R^{4-1} die oben angegebene Bedeutung hat,

15

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

20

oder indem man Verbindungen der Formel (I-b)

in welcher

X^1 für 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan) steht

25

mit (Hetero)cyclen der Formel (VII)

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 11 -

T—A
(VII)

in welcher A die oben angegebene Bedeutung hat und

5 T für Cl, Br, I, -OSO₂CF₃ steht

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säure-
bindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels
umsetzt.

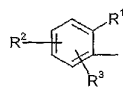
10

Schließlich wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel
(I) sehr gute insektizide Eigenschaften besitzen und sich sowohl im Pflanzenschutz
als auch im Materialschutz zur Bekämpfung unerwünschter Schädlinge, wie Insek-
ten, verwenden lassen.

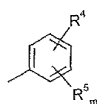
15

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

20 Ar¹ steht bevorzugt für den Rest



Ar² steht bevorzugt für den Rest



25

m steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3.

R¹ steht bevorzugt für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸.

R² und R³ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸.

R⁴ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindliche Gruppierungen

(l) -X-A
(m) -B-Z-D
(n) -Y-E

R⁵ steht bevorzugt für Halogen, Hydroxy, Cyano, -CONH₂, -CSNH₂, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyloxy, Tri(C₁-C₆-alkyl)-silyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, -CONR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶, (C₁-C₆-Halogenalkyl)aminosulfonyl, Bis(C₁-C₆-alkoxy)boran, -B(OH)₂.

X steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)₀, -NR⁶, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxy carbonyl, Oxy sulfonyl (OSO₂), C₁-C₄-Alkylen, C₂-C₄-Alkylen, C₂-C₄-Alkinylen, C₁-C₄-Alkylenoxy, C₁-C₄-Oxyalkylen, C₁-C₄-Oxyalkylenoxy, C₁-C₄-Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen.

A steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W² substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclus mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere

- Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl).
- 5 B steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes p-Phenylen.
- Z steht bevorzugt für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff oder $-S(O)_6-$.
- 10 D steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl.
- 15 Y steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Oxyalkyl, C₁-C₄-Oxyalkylenoxy, C₁-C₄-Thioalkyl.
- 20 E steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl.
- W¹ steht bevorzugt für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, Tri(C₁-C₄-alkyl)silyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C₁-C₆-Alkyl-carbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_6R^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.
- 25 W² steht bevorzugt für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, Tri(C₁-C₄-alkyl)silyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy,
- 30

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 14 -

C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C₁-C₆-Alkyl-carbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, -S(O)₆R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -C(R⁶)=N-O(R⁶).

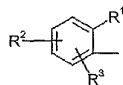
- 5 n steht bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.
- Q steht bevorzugt für -CO₂R⁹, -COR¹⁰, -CONR⁷R⁸, -CN, -CONH₂, -CSNH₂, -S(O)₆R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -PO(OR¹¹)₂, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe
- 10 Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel.
- Q steht außerdem bevorzugt für -CO₂R¹³ oder -CONR¹⁴R¹⁵.
- o steht bevorzugt für 0, 1 oder 2.
- 15 R⁶ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl.
- R⁷ und R⁸ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen.
- 20 R⁹ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Benzyl, Phenyl.
- R¹⁰ steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Benzyl.
- 25 R¹¹ steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, Phenyl.
- R¹² steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Benzyl oder Phenyl.
- 30 R¹³ steht bevorzugt für Wasserstoff; für einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl oder

2-Pyrrolidinon substituiertes C₁-C₆-Alkyl; für Aminocarbonyl-C₁-C₆-alkyl, welches an der Aminogruppe gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl, Phenyl oder Halogenphenyl substituiert sein kann; für C₂-C₈-Alkenyl, Phenyl-C₂-C₆-alkenyl; für Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenoxy-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiert sein können; für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können; für 5- oder 6-gliedriges gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Furyl, Thienyl, Pyridinyl, Furfuryl, Thenyl oder Pyridinylmethyl), wobei der Heterocyclus jeweils durch Halogen substituiert sein kann; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl.

R¹⁴ und R¹⁵ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl; für Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiert sein können; für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiert sein können; für 5- oder 6-gliedriges gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Furyl, Thienyl, Tetrahydrofuryl, Furfuryl, Thenyl, Tetrahydrofurylmethyl, Thiazolyl), wobei der Heterocyclus jeweils durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sein kann.

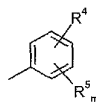
R¹⁴ und R¹⁵ stehen außerdem gemeinsam bevorzugt für C₁-C₄-Alkylenoxy-C₁-C₄-alkylen oder C₁-C₄-Alkylenthio-C₁-C₄-alkylen.

Ar¹ steht besonders bevorzugt für den Rest



5

Ar² steht besonders bevorzugt für den Rest



10 m steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

R¹ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy.

15

R² und R³ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy.

20 R⁴ steht besonders bevorzugt für Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindlichen Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

25

- R⁵ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, -CONH₂, -CSNH₂, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy, -OSO₂CF₃, -CONR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)₆R⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶, -B(OH)₂, 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan).
- 5
- X steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂-, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxsulfonyl (OSO₂), C₁-C₄-Alkylen, C₂-C₄-Alkenylen, C₂-C₄-Alkinylen, C₁-C₄-Alkylenoxy, C₁-C₄-Oxyalkylen, C₁-C₄-Oxyalkylenoxy, C₁-C₄-Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen.
- 10
- A steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W² substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocycl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazolyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl).
- 15
- 20
- B steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes p-Phenyl.
- 25
- Z steht besonders bevorzugt für -(CH₂)_n-, Sauerstoff oder -S(O)₆-.
- D steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, Di(C₁-C₄-Alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl.
- 30

- Y steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂-, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylen, C₂-C₆-Alkenylen, C₂-C₆-Alkinylen; jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkylen oder C₂-C₆-Alkenylen; C₁-C₄-Alkylenoxy, C₁-C₄-Oxyalkylen, C₁-C₄-Oxyalkylenoxy, C₁-C₄-Thioalkylen.
- E steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl.
- W¹ steht besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Formyl, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, (C₁-C₄-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, -S(O)₆R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -OSO₂R¹², -C(R⁶)=N-O(R⁶).
- W² steht besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, -OSO₂CF₃, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, -S(O)₆R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -C(R⁶)=N-O(R⁶).
- n steht besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3.
- Q steht besonders bevorzugt für -CO₂R⁹, -COR¹⁰, -CONR⁷R⁸, -CN, -PO(OR¹¹)₂, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel (insbesondere Dihydrodioxazin, Oxazolin, Thiazolin, Imidazolin, Tetrazol).
- Q steht außerdem besonders bevorzugt für -CO₂R¹³ oder -CONR¹⁴R¹⁵.

- o steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.
- R⁶ steht besonders bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl oder jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl.
- 5 R⁷ und R⁸ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, oder gemeinsam für C₄-C₅-Alkylen.
- 10 R⁹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Benzyl, Phenyl.
- R¹⁰ steht besonders bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl.
- 15 R¹¹ steht besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyl, Phenyl.
- R¹² steht besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyl oder für durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl.
- 20 R¹³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff; für einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Cyano, Nitro, Methoxy, Methoxycarbonyl oder 2-Pyrrolidinon substituiertes C₁-C₄-Alkyl; für Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, welches an der Aminogruppe gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl, Phenyl oder Halogenphenyl substituiert sein kann; für C₂-C₆-Alkenyl, Phenyl-C₂-C₅-alkenyl; für Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenoxy-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach durch Methyl substituiert sein können; für Furyl, Thienyl, Pyridinyl, Furfuryl, Thenyl oder Pyridinylmethyl,
- 25
- 30

welche jeweils im Heterocyclus durch Chlor substituiert sein können; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl.

R¹⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff.

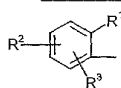
5

R¹⁵ steht besonders bevorzugt für C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl; für Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für Furyl, Thienyl, Tetrahydrofuryl, Furfuryl, Thenyl, Tetrahydrofurylmethyl, Thiazolyl oder durch C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiertes Thiazolyl.

10

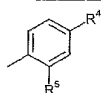
R¹⁴ und R¹⁵ stehen außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für Morpholino oder Thiomorpholino.

Ar¹ steht ganz besonders bevorzugt für den Rest



20

Ar² steht ganz besonders bevorzugt für den Rest



- R¹ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy.
- 5 R² und R³ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy.
- 10 R⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Chlor, Brom oder eine der folgenden Gruppierungen
- (l) -X-A
(m) -B-Z-D
(n) -Y-E
- 15 R⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluomethyl, Difluor-methoxy, Trifluormethoxy, Trifluormethylthio, -OSO₂CF₃, -OSO₂NMe₂ oder -SO₂CF₃.
- 20 R⁵ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.
- X steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂-, Carbonyl, -CH₂-, -(CH₂)₂-, -CH=CH- (E oder Z), -C≡C-, -CH₂O-,
- 25 -(CH₂)₂O-, -OCH₂-, -SCH₂-, -S(CH₂)₂-, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O-.
- A steht ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes Phenyl, oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W² substituiertes
- 30 Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Ox-

azolyl, Benzoxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazolyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl.

- 5 B steht ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes p-Phenylen.
- Z steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder -SO₂.
- 10 D steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, -CF₃, -CHF₂, -CClF₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, -SO₂CF₃, -SO₂(CF₂)₃CF₃, -SO₂NMe₂.
- 15 Y steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂, Carbonyl, -CH₂, -(CH₂)₂, -CH=CH- (E oder Z), -C≡C-, -CH₂O-, -(CH₂)₂O-, -OCH₂-, -SCH₂-, -S(CH₂)₂-, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O-.
- 20 E steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, -CF₃, -CHF₂, -CClF₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, -SO₂CF₃, -SO₂(CF₂)₃CF₃, -SO₂NMe₂.
- 25 W¹ steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, -CF₃, -CHF₂, -CClF₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -OCH₂CF₃, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -SO₂NMe₂, -OSO₂CH₃,
- 30

WO 02/24646

- 23 -

PCT/EP01/10422

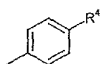
-OSO₂CF₃, -OSO₂(CF₂)₃CF₃, -COCH₃, -CO₂CH₃, -CO₂Et, -SO₂Me,
-OSO₂NMe₂, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

- W² steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl,
5 Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethylthio, -OSO₂CF₃, -COCH₃, -CO₂CH₃, -OCH₂CF₃, -SO₂CF₃, -SO₂NMe₂, -OSO₂NMe₂, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.
- 10 Q steht ganz besonders bevorzugt für -CO₂CH₃, -CO₂CH₂CH₃, -CO₂-n-Propyl, -CO₂-Isopropyl, -CO₂-n-Butyl, -CO₂-Isobutyl, -CO₂-sec-Butyl, -CO₂-tert-Butyl, -CO₂-n-Pentyl, -CO₂-Neopentyl, -CO₂-sec-Isoamyl, -CO₂-Pentan-3-yl, -CO₂-Cyclopentyl, -CO₂-n-Hexyl, -CO₂-Cyclohexyl, -CO₂-Trifluorethyl, -CO₂CH₂Ph, -CO₂Ph, -COCH₃, -COCH₂CH₃, -CO-n-Propyl, -CONHMe,
15 -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), -CONMe₂, -CONEt₂, -CON(n-Propyl)₂, -CON(Isopropyl)₂, -CON(n-Butyl)₂, -CON(n-Pentyl)₂, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, -PO(OMe)₂, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl, -PO(OEt)₂, -PO(OPh)₂, Dihydrodioxacyl, Oxazoly, Thiazoly, Imidazoly, Tetrazoly.
- 20 Q steht außerdem ganz besonders bevorzugt für -CO₂CH₂CN, -CO₂(CH₂)₂CN, -CO₂(CH₂)₃CN, -CO₂H, -CO₂CH₂C(CH₃)₂NO₂, -CO₂(CH₂)₂OCH₃, 2-Methoxycarbonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethylloxycarbonyl, -CO₂(CH₂)₃CH=CH₂, -CO₂(CH₂)₂C(CH₃)=CH₂, -CO₂CH₂CH=CH-Ph, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxycarbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethyloxycarbonyl, 3-Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethyloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethyloxycarbonyl, 1-Cyclohexylethyloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyl-
- 25
30

oxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethyloxycarbonyl, 1-Tetrahydronaphthylloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, -CON(H)CH₂CF₃, Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbonyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenylaminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-aminocarbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl.

15

Ar² steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für den Rest



R¹ steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

20

R² steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor oder Fluor.

R⁴ steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für -B-Z-D.

25

B steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für p-Phenylen.

Z steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

D steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für -CF₃.

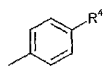
30

- Q steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für $-\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$,
 $-\text{CO}_2$ -n-Propyl, $-\text{CO}_2$ -Isopropyl, $-\text{CO}_2$ -n-Butyl, $-\text{CO}_2$ -Isobutyl, $-\text{CO}_2$ -sec-
 Butyl, $-\text{CO}_2$ -tert-Butyl, $-\text{CO}_2$ -n-Pentyl, $-\text{CO}_2$ -Neopentyl, $-\text{CO}_2$ -sec-Isoamyl,
 5 $-\text{CO}_2$ -Pentan-3-yl, $-\text{CO}_2$ -Cyclopentyl, $-\text{CO}_2$ -n-Hexyl, $-\text{CO}_2$ -Cyclohexyl,
 $-\text{CONHMe}$, $-\text{CONHEt}$, $-\text{CONH(n-Propyl)}$, $-\text{CONH(Isopropyl)}$,
 $-\text{CONH(n-Butyl)}$, $-\text{CONH(tert-Butyl)}$, $-\text{CONH(n-Pentyl)}$, $-\text{CONH(n-Hexyl)}$,
 $-\text{CONH(Cyclohexyl)}$, $-\text{CONMe}_2$, $-\text{CONEt}_2$, $-\text{CON(n-Propyl)}_2$, $-\text{CON(Isopro-}$
 $-\text{CON(n-Butyl)}_2$, $-\text{CON(n-Pentyl)}_2$, $-\text{CON(Me)Et}$, $-\text{CON(Me)n-Propyl}$,
 10 $-\text{CON(Me)n-Butyl}$, $-\text{CON(Me)n-Pentyl}$, $-\text{CN}$, Pyrrolidinocarbonyl, Piperi-
 dinocarbonyl.

Ar¹ steht hervorgehoben für den Rest



15 Ar² steht hervorgehoben für den Rest



R¹ steht hervorgehoben für Fluor oder Chlor.

R² steht hervorgehoben für Wasserstoff, Chlor oder Fluor.

20

R⁴ steht hervorgehoben für -B-Z-D.

B steht hervorgehoben für p-Phenylen.

25 Z steht hervorgehoben für Sauerstoff oder Schwefel.

D steht hervorgehoben für $-\text{CF}_3$.

- Q steht hervorgehoben für -CO₂CH₃, -CO₂CH₂CH₃, -CO₂-n-Propyl, -CO₂-Iso-propyl, -CO₂-n-Butyl, -CO₂-Isobutyl, -CO₂-sec-Butyl, -CO₂-tert-Butyl, -CO₂-n-Pentyl, -CO₂-Neopentyl, -CO₂-sec-Isoamyl, -CO₂-Pentan-3-yl, -CO₂-Cyclopentyl, -CO₂-n-Hexyl, -CO₂-Cyclohexyl, -CONHMe, -CONHEt, 5 -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH-(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), -CONMe₂, -CONEt₂, -CON(n-Propyl)₂, -CON(Isopropyl)₂, -CON(n-Butyl)₂, -CON(n-Pentyl)₂, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl.
- Q steht außerdem hervorgehoben für -CO₂H, -CO₂CH₂CN, -CO₂(CH₂)₂CN, -CO₂(CH₂)₃CN, -CO₂CH₂C(CH₃)₂NO₂, -CO₂(CH₂)₂OCH₃, 2-Methoxycar-bonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethylloxycarbonyl, 15 -CO₂(CH₂)₃CH=CH₂, -CO₂(CH₂)₂C(CH₃)=CH₂, -CO₂CH₂CH=CH-Ph, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxycarbonyl, 4-Chlorbenzyloxycar-bonyl, 1-Phenylethylloxycarbonyl, 3-Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxy-ethylloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethyloxy-carbonyl, 1-Cyclohexylethylloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyl-oxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridi-nylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethyloxycarbonyl, 1-Tetrahy-dronaphthylloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, -CON(H)CH₂CF₃, Meth-oxylethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbonyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlorbenzyl-amino-25 carbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxy-benzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethyl-benzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethyl-cyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenyl-aminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-amino-30 carbonyl.

WO 02/24646

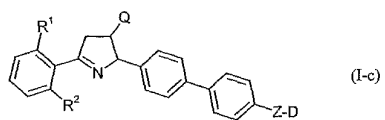
- 27 -

PCT/EP01/10422

carbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl.

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formel (I-c)

5

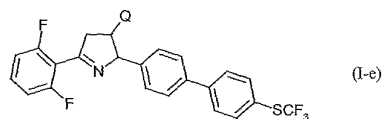
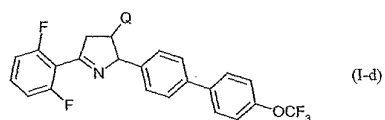


in welcher

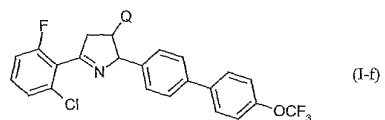
R¹, R², Z, D und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben.

10

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)



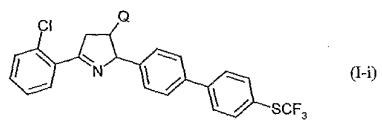
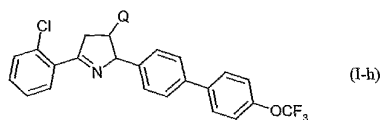
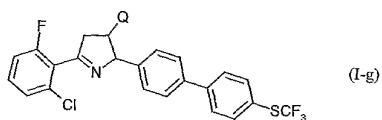
15



WO 02/24646

- 28 -

PCT/EP01/10422



in denen

5

Q für $-\text{CO}_2\text{R}^9$, $-\text{CONHR}^8$ oder $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ steht,wobei R^7 , R^8 und R^9 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

10 Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)

in welchen

15

Q für CO_2R^{13} oder $-\text{CONR}^{14}\text{R}^{15}$ steht,wobei R^{13} , R^{14} und R^{15} die oben angegebenen Bedeutungen haben.

20 Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)

in welchen

- Q für -CO₂CH₃, -CO₂CH₂CH₃, -CO₂-n-Propyl, -CO₂-Isopropyl, -CO₂-n-Butyl,
 -CO₂-Isobutyl, -CO₂-sec-Butyl, -CO₂-tert-Butyl, -CO₂-n-Pentyl, -CO₂-Neo-
 5 pentyl, -CO₂-sec-Isoamyl, -CO₂-Pentan-3-yl, -CO₂-Cyclopentyl, -CO₂-
 n-Hexyl, -CO₂-Cyclohexyl, -CONHCH₃, -CONHCH₂CH₃, -CONH-
 (n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl),
 -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), -CONMe₂,
 -CONEt₂, -CON(n-Propyl)₂, -CON(Isopropyl)₂, -CON(n-Butyl)₂,
 10 -CON(n-Pentyl)₂, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl,
 -CON(Me)n-Pentyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl steht.

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d),
 (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)

15

in welchen

- Q für -CO₂CH₂CN, -CO₂(CH₂)₂CN, -CO₂(CH₂)₃CN, -CO₂CH₂C(CH₃)₂NO₂,
 -CO₂(CH₂)₂OCH₃, -CO₂H, 2-Methoxycarbonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-
 20 Oxo-1-pyrrolidinyloxypropyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-
 2-oxo-ethyloxycarbonyl, -CO₂(CH₂)₃CH=CH₂, -CO₂(CH₂)₂C(CH₃)=CH₂,
 -CO₂CH₂CH=CH-Ph, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxy-
 carbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethyloxycarbonyl, 3-Phenyl-
 propyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethyloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxy-
 25 carbonyl, Cyclohexylmethyloxycarbonyl, 1-Cyclohexylethyloxycarbonyl, 3-
 Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyloxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridi-
 nylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinyl-
 methyloxycarbonyl, 1-Tetrahydronaphthylloxycarbonyl, 1-Indanyloxycar-
 30 bonyl, -CON(H)CH₂CF₃, Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxy-
 phenyl-aminocarbonyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbo-
 nyl, 3-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methyl-

benzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenyl-aminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-aminocarbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl steht.

Eine weitere bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen

10

Q für $-\text{CO}_2\text{R}^9$, $-\text{COR}^{10}$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, $-\text{CN}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CSNH}_2$, $-\text{S(O)}_6\text{R}^6$, $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{PO(OR}^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, und

15

Ar^1 , Ar^2 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} und R^{11} die oben angegebenen allgemeinen Bedeutungen haben.

Eine weitere bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen

20

Q für $-\text{CO}_2\text{R}^9$, $-\text{COR}^{10}$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, $-\text{CN}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CSNH}_2$, $-\text{S(O)}_6\text{R}^6$, $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{PO(OR}^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, steht und

25

Ar^1 , Ar^2 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} und R^{11} die oben angegebenen bevorzugten Bedeutungen haben.

Eine weitere bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen

30

Q für $-\text{CO}_2\text{R}^9$, $-\text{COR}^{10}$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, $-\text{CN}$, $-\text{PO}(\text{OR}^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel (insbesondere Dihydrodioxacin, Oxazolin, Thiazolin, Imidazolin, Tetrazol) steht und

5

Ar^1 , Ar^2 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} und R^{11} die oben angegebenen besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

10

Eine weitere bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen

Q für $-\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CO}_2\text{-n-Propyl}$, $-\text{CO}_2\text{-Isopropyl}$, $-\text{CO}_2\text{-n-Butyl}$, $-\text{CO}_2\text{-Isobutyl}$, $-\text{CO}_2\text{-sec-Butyl}$, $-\text{CO}_2\text{-tert-Butyl}$, $-\text{CO}_2\text{-n-Pentyl}$, $-\text{CO}_2\text{-Neopentyl}$, $-\text{CO}_2\text{-sec-Isoamyl}$, $-\text{CO}_2\text{-Pentan-3-yl}$, $-\text{CO}_2\text{-Cyclopentyl}$, $-\text{CO}_2\text{-n-Hexyl}$, $-\text{CO}_2\text{-Cyclohexyl}$, $-\text{CO}_2\text{-Trifluorethyl}$, $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$, $-\text{CO}_2\text{Ph}$, $-\text{COCH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CO-n-Propyl}$, $-\text{CONHMe}$, $-\text{CONHEt}$, $-\text{CONH-(n-Propyl)}$, $-\text{CONH(Isopropyl)}$, $-\text{CONH(n-Butyl)}$, $-\text{CONH(tert-Butyl)}$, $-\text{CONH(n-Pentyl)}$, $-\text{CONH(n-Hexyl)}$, $-\text{CONH(Cyclohexyl)}$, $-\text{CONMe}_2$, $-\text{CONEt}_2$, $-\text{CON(n-Propyl)}_2$, $-\text{CON(Isopropyl)}_2$, $-\text{CON(n-Butyl)}_2$, $-\text{CON(n-Pentyl)}_2$, $-\text{CON(Me)Et}$, $-\text{CON(Me)n-Propyl}$, $-\text{CON(Me)n-Butyl}$, $-\text{CON(Me)n-Pentyl}$, $-\text{CN}$, $-\text{PO(OMe)}_2$, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl, $-\text{PO(OEt)}_2$, $-\text{PO(OPh)}_2$, Dihydrodioxacinyll, Oxazolyl, Thiazolyl, Imidazolyl, Tetrazolyl steht und

15

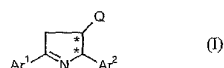
20

25

Ar^1 , Ar^2 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} und R^{11} die oben angegebenen ganz besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

30

Die allgemeine Formel (I) besitzt zwei, hier durch * gekennzeichnete, Asymmetriezentren.



Bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in denen die Substituenten Q und Ar² an den beiden chiralen Zentren cis-ständig sind.

5

In den oben genannten Definitionen stehen Oxyalkylen bzw. Thioalkylen für -O-Alkyl- bzw. -S-Alkyl-, wobei die Bindung z.B. an Ar² über das Sauerstoff- bzw. Schwefelatom erfolgt und am Alkylrest gegebenenfalls weitere Substituenten wie z.B. A in -X-A gebunden sind. Alkylenoxy bzw. Alkylenthio stehen für -Alkyl-O- bzw. -Alkyl-S-, wobei die Bindung z.B. an Ar² jeweils über den Alkylrest erfolgt und am Sauerstoff- bzw. Schwefelatom gegebenenfalls weitere Substituenten wie z.B. A in -X-A gebunden sind. Oxyalkylenoxy steht für -O-Alkyl-O-.

10

Heterocyclyl steht in der vorliegenden Beschreibung für einen gesättigten oder ungesättigten cyclischen Kohlenwasserstoff in welchem einer oder mehrere Kohlenstoffatome durch ein oder mehrere Heteroatome ausgetauscht sind. Heteroatome steht dabei bevorzugt für O, S, N, P, insbesondere für O, S und N.

15

Bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen, welche die unter bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt genannten Substituenten tragen.

20

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

25

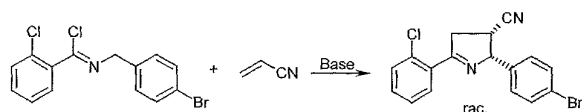
Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein

können. Mehrere Reste mit denselben Indizes wie beispielsweise m Reste R^5 für $m > 1$, können gleich oder verschieden sein.

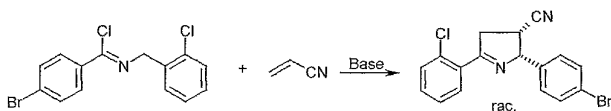
5 Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

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

15 Verwendet man N-(4-Brombenzyl)-2-chlorphenyl-carboximidoyl-chlorid und Acrylnitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



20 Verwendet man N-(2-chlorbenzyl)-4-bromphenyl-carboximidoyl-chlorid und Acrylnitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-2) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



25

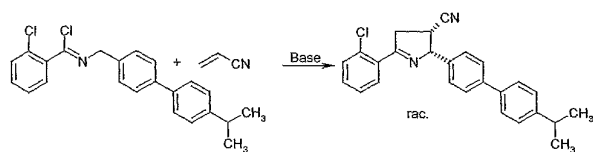
WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 34 -

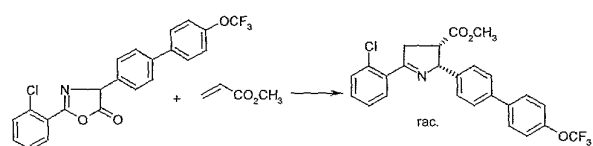
Verwendet man 2-Chlor-N-[(4'-isopropyl-1,1'-biphenyl-4-yl)methyl]benzocarbonylimidoyl-chlorid und Acrylnitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

5



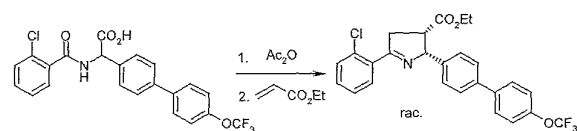
Verwendet man 2-(2'-Chlorbenzyl)-4-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl]oxazolidin-5-on und Acrylsäuremethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

10



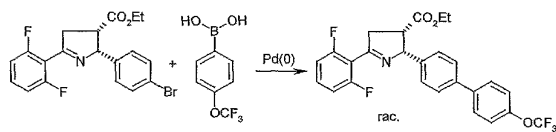
Verwendet man N-(2-Chlorbenzoyl)-2-[(4'-trifluormethoxy)biphenyl]glycin und Essigsäureanhydrid und Acrylsäureethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

20



Verwendet man 2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrole-3-carbonsäureethylester und 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

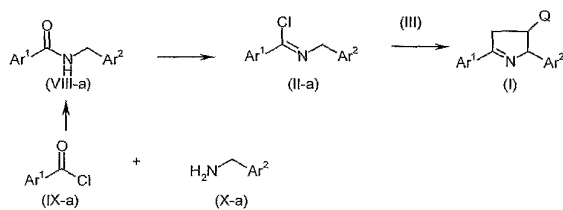
5



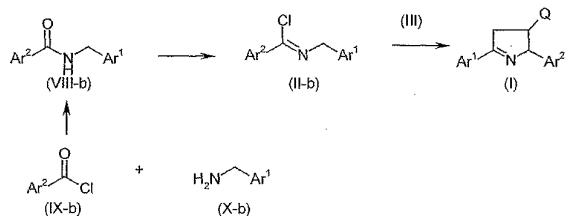
Erläuterungen der Verfahren und Zwischenprodukte:

10

Verfahren (A-1)



Verfahren (A-2)



15

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Iminochloride sind durch die Formeln (II-a) und (II-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Die zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Iminochloride der Formeln (II-a) und (II-b) lassen sich herstellen, indem man Amide der Formeln (VIII-a) und (VIII-b) mit einem Chlorierungsreagenz (z.B. $SOCl_2$) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt. (Für weitere Methoden siehe „The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond“, in Patai, Interscience, New York, 1970, S. 597-662).

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Amide sind durch die Formeln (VIII-a) und (VIII-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

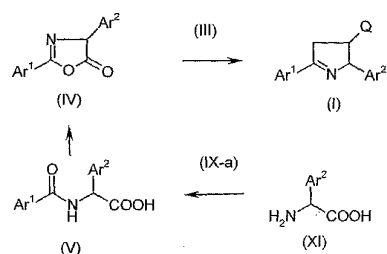
Amide der Formeln (VIII-a) und (VIII-b) lassen sich z.B. herstellen, indem man Säurechloride der Formeln (IX-a) und (IX-b) mit Benzylaminen der Formeln (X-a) und (X-b) in Gegenwart einer Base (z.B. Et_3N oder $NaOH$) und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Säurechloride und Benzylamine sind durch die Formeln (IX-a) und (IX-b) bzw. durch die Formeln (X-a) und (X-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der

Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

- 5 Säurechloride der Formeln (IX-a) und (IX-b) sind allgemein bekannt. Benzylamine der Formeln (X-a) und (X-b) sind zum Teil bekannt, können aber aus den entsprechenden Nitrilen bzw. Aldehyden über bekannte Methoden (Reduktion bzw. reduktive Aminierung) hergestellt werden (s. z.B. Vogel's Textbook Of Practical Organic Chemistry, Fifth Edition 1989, John Wiley and Sons, New York, Author: Vogel, Arthur, Israel; Revised by Furniss, Hannaford, Smith, and Tatchell, ISBN 0-582-46236-3).
- 10

Verfahren (B)

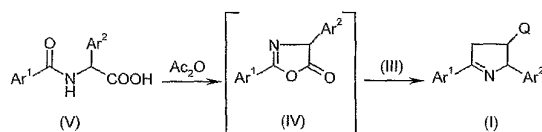


- 15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Oxazolidinone sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Ar¹ und Ar² bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.
- 20

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Oxazolidinone der Formel (IV) lassen sich analog zu den in der Literatur bekannten Beispielen aus N-Benzoyl-aminosäuren der Formel (V) herstellen. Oxazoli-

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten N-Benzoyl-aminosäuren sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verfahren (C)



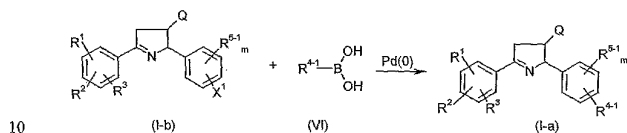
Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B) und (C) als Ausgangsstoffe benötigten Dipolarophile sind durch die Formel (III) allge-

mein definiert. In dieser Formel steht Q bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

5

Verbindungen der Formel (III) (Q = Ester, Nitril, Keton, Amid, Phosphorester, Sulfon) sind allgemein bekannt bzw. kommerziell erhältlich.

Verfahren (D)



15

Für den Fall, dass Ar² im erfindungsgemäßen Wirkstoff der Formel (I) für ein gegebenenfalls substituiertes Biphenyl steht, lassen sich Verbindungen der Formel (I-a) herstellen, indem man Verbindungen der Formel (I-b) mit Boronsäuren der Formel (VI) in Gegenwart eines Palladium-Katalysators und in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittel kuppelt.

20

In Verbindungen der Formeln (I-a) bzw. (I-b) stehen R¹, R², R³ und m bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

25

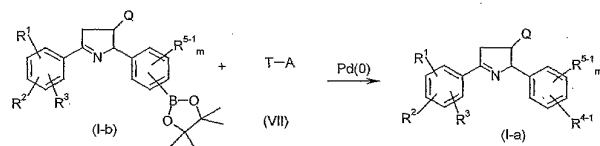
R⁵⁻¹ steht bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Tri(C₁-C₆-alkyl)-silyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, -CONR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶, (C₁-C₆-Halogenalkyl)aminosulfonyl.

- R⁵⁻¹ steht besonders bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy, -CONR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)₆R⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶.
- 5 R⁵⁻¹ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, -OSO₂NMe₂ oder -SO₂CF₃.
- 10 In Verbindungen der Formel (I-b) steht X¹ bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom, ganz besonders bevorzugt für Brom.
- In Verbindungen der Formeln (I-a) und (VI) steht R⁴⁻¹ für A oder -B-Z-D. A, B, Z und D stehen dabei bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen,
- 15 die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.
- Verbindungen der Formel (I-b) werden über Verfahren A, B oder C hergestellt.
- 20 Boronsäuren der Formel (VI) sind z. Teil bekannt, können aber auch ausgehend vom (Brom)aromaten durch Lithiierung bzw. Br-Li (Mg)-austausch und anschließende Umsetzung mit Trisalkoxyborverbindungen hergestellt werden (vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 1993, **34**, 8237-8240).
- 25 Weiterhin können Verbindungen der Formel (I-a) ausgehend von Verbindungen der Formel (I-b) [X¹ = 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan) und (Hetero)cyclen der Formel (VII) analog Literatur bekannten Methoden (J.Org. Chem. 1995, **60**, 7508; Tetrahedron Lett. 1997, **38**, 3841) hergestellt werden.

WO 02/24646

- 41 -

PCT/EP01/10422



In den (Hetero)cyclen der Formel (VII) steht T bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom, ganz besonders bevorzugt für Chlor. A steht bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Verbindungen der Formel (VII) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden.

10

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man im allgemeinen einen Palladium-Katalysator ein, der wiederum mit oder ohne Zusatz von weiteren Liganden verwendet werden kann. Vorzugsweise verwendet man als Katalysator $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ [$\text{dppf} = 1,1'$ -Bis(diphenylphosphino)ferrocene], $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$, $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$, $\text{PdCl}_2(\text{CH}_3\text{CN})_2$, $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ [$\text{dba} = \text{Dibenzylidenacetone}$] oder $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, besonders bevorzugt $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$, $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$, $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ oder $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, ganz besonders bevorzugt $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ oder $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$. Als Liganden kommen Triarylphosphine, Trialkylphosphine oder Arsine in Frage. Vorzugsweise verwendet man dppf , PPh_3 , $\text{P}(\text{t-Bu})_3$, Pcy_3 oder AsPh_3 , besonders bevorzugt dppf .

20

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) erhält man Verbindungen der Formel (I) bzw. (I-a), in welchen Q für $-\text{CO}_2\text{H}$ steht, indem man z.B. die entsprechenden Methylester nach bekannten Verfahren verseift (vgl. T.W. Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd edition, S. 232-234).

25

- Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Es ist jedoch auch möglich, ohne zusätzliches Säurebindemittel zu arbeiten, oder die Aminkomponente in einem Überschuss einzusetzen, so dass sie gleichzeitig als Säurebindemittel fungiert.
- Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan.
- Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils in einem größeren Bereich variiert

werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 140°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

5 Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) arbeitet man im allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

10 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) oder (A-2) setzt man auf 1 Mol an Iminochlorid der Formeln (II-a) oder (II-b) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) sowie 1 bis 3 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Um-

15 kristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man auf 1 Mol an Oxazolinon der Formel (IV) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen ver-

20 fährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

25 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) setzt man auf 1 Mol an Carbonsäure der Formel (V) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) sowie 1 bis 3 Mol an Essigsäureanhydrid ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das

30 Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls

nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man auf 1 Mol an Verbindungen der Formeln (I) im allgemeinen 1 Mol an Dipolarophil der Formel (III) oder auch einen Überschuss daran, sowie 1 bis 5 Mol an Säurebindemittel und 1/20 mol Katalysator ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch zwischen Wasser und Methyl-tert-butylether verteilt, die organische Phase über Natriumsulfat trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblüttoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

- Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.
- Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.
- Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp.
- Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera immaculata*.
- Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.
- Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.
- Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

- Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.
- Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.
- Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp..
- 5 Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp..
- Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella accidentalis*.
- Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*,
- 10 *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.
- Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*,
- 15 *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.
- Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella*
- 20 *xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Buccatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Tri-choplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus*
- 25 spp., *Oulema oryzae*.
- Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*,
- 30 *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Antho-*

- nomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes acneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp.,
- 5 Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.
- Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.
- Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp.,
- 10 Chrysomya spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..
- 15 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..
- Aus der Klasse der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptura oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp.,
- 20 Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..
- Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..
- 25 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere durch eine hervorragende Wirkung gegen Raupen, Käferlarven, Spinnmilben, Blattläuse und Minierfliegen aus.
- 30

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere ganz besonders durch hervorragende Wirkung gegen Larven des Meerettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*), Raupen des Eulenfalters (*Spodoptera frugiperda*), Larven der Grünen Reiszikade (*Nephotettix cincticeps*), Pfirsichblattläuse (*Myzus persicae*) und alle Stadien der gemeinen Spinnmilbe (*Tetranychus urticae*) aus.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch als Herbizide und Mikrobizide, beispielsweise als Fungizide, Antimykotika und Bakterizide verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbarer oder nicht schützbarer 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 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 üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen,

Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

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

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

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

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

- thetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängeln;
- 5 als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykoether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate;
- 10 als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
- Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden,
- 15 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, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.
- 20
- Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.
- 25
- Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit anderen, auch bekannten Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In
- 30

vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

- 10 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon,
- 15 Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinal, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph,
- 20 Dodine, Drazoxolon, Edifenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol, Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam,
- 25 Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumecyclox, Guazatin,
- 30 Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

- Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovalledione,
- 5 Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,
- Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipirim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,
- 10 Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthin, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenoxy, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,
- 15 Quinconazol, Quintozen (PCNB), Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol,
- 20 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol, Zailamid, Zineb, Ziram sowie
- 25 Dagger G, OK-8705, OK-8801, α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor- β -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylene]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- 30 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,

- (E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
 {2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-
 1-isopropylester
 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
 5 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
 1-[(Diiodomethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
 10 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carbox-
 anilid,
 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropanecarboxamid,
 15 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
 2,6-Dichlor-N-[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
 20 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- β -D-glycopyranosyl)- α -D-glucopyranosyl]-amino]-4-
 methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
 2-Aminobutan,
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
 25 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyantomethyl)-acetamid,
 2-Phenylphenol(OPP),
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 3-(1,1-Dimethylpropyl)-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
 30 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,

- 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
 8-Hydroxychinolinsulfat,
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
 5 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-
 hydrochlorid,
 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
 10 Kaliumhydrogencarbonat,
 Methantetrathiol-Natriumsalz,
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
 15 N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzosulfonamid,
 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 20 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
 N-(6-Methoxy)-pyridin-3-yl)-cyclopropancarboxamid,
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
 25 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioat,
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
 30 4-[(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 54 -

Bakterizide:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Othilolin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

5

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

10 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

15 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin,

20 Cyromazine, Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofof, Diiflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopffthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,

25 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocyrthinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate,

30 Fubfenprox, Furathiocarb,

Granuloseviren

- Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,
 Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,
 Kempolyederviren
 Lambda-cyhalothrin, Lufenuron
- 5 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
 Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl,
 Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazon, Mevinphos, Milbemectin, Milbe-
 mycin, Monocrotophos,
 Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron
- 10 Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M
 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat,
 Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A,
 Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat,
 Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimi-
 15 difen, Pyriproxyfen,
 Quinalphos,
 Ribavirin
 Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,
 Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,
 20 Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Theta-
 cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatrithos, Thiocyclam
 hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin,
 Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon,
 Triflumuron, Trimethacarb,
 25 Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii
 Y1 5302
 Zeta-cypermethrin, Zolaprofos
 (1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furany-
 liden)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat
 30 (3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

- 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin
- 2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol
- 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
- 5 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 3-Methylphenyl-propylcarbamate
- 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
- 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-
- 10 3(2H)-pyridazinon
- 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon
- 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon
- Bacillus thuringiensis strain EG-2348
- 15 Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid]
- Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-ester
- [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
- Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd
- 20 Ethyl-2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamate
- N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin
- N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid
- N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin
- 25 N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid
- N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid
- O,O-Diethyl-2-(dipropylamino)-2-oxoethyl-ethylphosphoramidothioat
- N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid
- 3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-propoxy]-benzol
- 30

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

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

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

15 Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

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

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder
25 Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von
30 Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit bestimmten Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken erhalten worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch über additive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide

- Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden.
- 5 Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im
- 10 folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigen-
- 15 schaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. „PAT“-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als
- 20 Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotr® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und
- 25 Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbst-
- 30 verständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zu-

künftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

10

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

15

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

20

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

25

Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp.,

30

Sarcophaga spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp..

- Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp..
- 5 Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp..
- Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp..
- 10 Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Stenomostoma* spp., *Varroa* spp..
- 15 Aus der Ordnung der Actiniedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp.,
- 20 *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..
- Beispielsweise zeigen sie eine hervorragende Wirksamkeit gegen die Entwicklungsstadien von Zecken wie zum Beispiel *Amblyomma hebraeum*, gegen parasitierende
- 25 Fliegen wie zum Beispiel gegen *Lucilia cuprina*.
- Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse,
- 30 Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und

Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

5

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

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

Außerdem wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.
25

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

Käfer wie
30 *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 63 -

- Lycetus brunneus, Lycetus africanus, Lycetus planicollis, Lycetus linearis, Lycetus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis, Xyleborus spec. Trypodendron spec. Apate monachus, Bostrychus capucinus, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec. Dinoderus minutus.
- 5 Hautflügler wie
Sirex juvenicus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur.
- Termiten wie
- 10 Kaloterms flavicollis, Cryptoterms brevis, Heteroterms indicola, Reticuliterms flavipes, Reticuliterms santonensis, Reticuliterms lucifugus, Mastoterms darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptoterms formosanus.
- Borstenschwänze wie Lepisma saccharina.
- 15 Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.
- 20 Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.
- Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft
- 25 zu verstehen:
- Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.
- 30

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

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

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

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

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

- Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölarartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölarartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle
- 30

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 65 -

oder deren Aromatenfraktionen oder mineralöhlhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

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

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

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

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

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

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

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

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

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 67 -

Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykol-ether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

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

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

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

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

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

20 Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyrifos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyfenozide und Triflumuron, sowie Fungizide wie Epoxyconazole, 25 Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolyfluamid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamate, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.

30 Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken,

Kaialagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

5 Bewuchs durch sessile Oligochaeten, wie Kalkröhrenwürmer sowie durch Muscheln und Arten der Gruppe Ledamorpha (Entenmuscheln), wie verschiedene Lepas- und Scalpellum-Arten, oder durch Arten der Gruppe Balanomorpha (Seepocken), wie Balanus- oder Pollicipes-Species, erhöht den Reibungswiderstand von Schiffen und führt in der Folge durch erhöhten Energieverbrauch und darüber hinaus durch häufige Trockendockaufenthalte zu einer deutlichen Steigerung der Betriebskosten.

10 Neben dem Bewuchs durch Algen, beispielsweise Ectocarpus sp. und Ceramium sp., kommt insbesondere dem Bewuchs durch sessile Entomostraken-Gruppen, welche unter dem Namen Cirripedia (Rankenflussekrebse) zusammengefasst werden, besondere Bedeutung zu.

15 Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, eine hervorragende Antifouling (Antibewuchs)-Wirkung aufweisen.

20 Durch Einsatz von erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, kann auf den Einsatz von Schwermetallen wie z.B. in Bis(trialkylzinn)-sulfiden, Tri-*n*-butylzinnlaurat, Tri-*n*-butylzinncchlorid, Kupfer(I)-oxid, Triethylzinncchlorid, Tri-*n*-butyl(2-phenyl-4-chlorphenoxy)-zinn, Tributylzinnoxid, Molybdädisulfid, Antimonoxid, polymerem Butyltitanat, Phenyl-(bispyridin)-
25 wismutchlorid, Tri-*n*-butylzinncfluorid, Manganethylenbisthiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisthiocarbamat, Zink- und Kupfersalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Bisdimethyldithiocarbamoylzinkethylenbisthiocarbamat, Zinkoxid, Kupfer(I)-ethylen-bisdithiocarbamat, Kupferthiocyanat, Kupfernaphtenat und Tributylzinnchalogeniden verzichtet werden oder die Konzentration dieser Verbindungen entscheidend reduziert werden.

30

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 69 -

Die anwendungsfertigen Antifoulingfarben können gegebenenfalls noch andere Wirkstoffe, vorzugsweise Algizide, Fungizide, Herbizide, Molluskizide bzw. andere Antifouling-Wirkstoffe enthalten.

- 5 Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel eignen sich vorzugsweise:

Algizide wie

- 10 2-*tert*-Butylamino-4-cyclopropylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine und Terbutryn;

Fungizide wie

- 15 Benzo[*b*]thiophencarbonsäurecyclohexylamid-S,S-dioxid, Dichlofluamid, Fluorfolpet, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamate, Tolyfluanid und Azole wie Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole;

Molluskizide wie

- 20 Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb; oder herkömmliche Antifouling-Wirkstoffe wie 4,5-Dichlor-2-octyl-4-isothiazolin-3-on, Diiodmethylparatrylsulfon, 2-(N,N-Dimethylthiocarbamoylthio)-5-nitrothiazyl, Kalium-, Kupfer-, Natrium- und Zinksalze von 2-Pyridinethiol-1-oxid, Pyridin-triphenylboran, Tetrabutylidstannoxan, 2,3,5,6-
25 Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin, 2,4,5,6-Tetrachlorisophthalonitril, Tetramethylthiuramdisulfid und 2,4,6-Trichlorphenylmaleinimid.

- Die verwendeten Antifouling-Mittel enthalten die erfindungsgemäßen Wirkstoff der erfindungsgemäßen Verbindungen in einer Konzentration von 0,001 bis 50 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20 Gew.-%.
- 30

Die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel enthalten des weiteren die üblichen Bestandteile wie z.B. in Ungerer, *Chem. Ind.* **1985**, 37, 730-732 und Williams, *Antifouling Marine Coatings*, Noyes, Park Ridge, **1973** beschrieben.

- 5 Antifouling-Anstrichmittel enthalten neben den algiziden, fungiziden, molluskiziden und erfindungsgemäßen insektiziden Wirkstoffen insbesondere Bindemittel.

- Beispiele für anerkannte Bindemittel sind Polyvinylchlorid in einem Lösungsmittelsystem, chlorierter Kautschuk in einem Lösungsmittelsystem, Acrylharze in einem Lösungsmittelsystem insbesondere in einem wässrigen System, Vinylchlorid/Vinylacetat-Copolymerensysteme in Form wässriger Dispersionen oder in Form von organischen Lösungsmittelsystemen, Butadien/Styrol/Acrylnitril-Kautschuke, trocknende Öle, wie Leinsamenöl, Harzester oder modifizierte Hartharze in Kombination mit Teer oder Bitumina, Asphalt sowie Epoxyverbindungen, geringe Mengen Chlorkautschuk, chloriertes Polypropylen und Vinylharze.
- 10
15

- Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling-Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten Mischungen eingearbeitet werden.
- 20
25

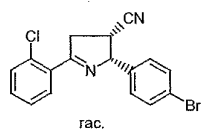
- Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten
- 30

verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam. Zu diesen Schädlingen gehören:

- Aus der Ordnung der Scorpionidea z.B. *Buthus occitanus*.
- 5 Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides farinae*.
- Aus der Ordnung der Araneae z.B. *Aviculariidae*, *Araneidae*.
- 10 Aus der Ordnung der Opiliones z.B. *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.
- Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.
- Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp..
- Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus* spp..
- 15 Aus der Ordnung der Zygentoma z.B. *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.
- Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.
- 20 Aus der Ordnung der Saltatoria z.B. *Acheta domesticus*.
- Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.
- Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Kaloterms* spp., *Reticuliterms* spp.
- Aus der Ordnung der Psocoptera z.B. *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.
- 25 Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
- Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*,
- 30

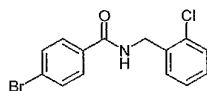
- Musca domestica, Phlebotomus spp., Sarcophaga carnaria, Simulium spp., Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa.
- Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Achroia grisella, Galleria mellonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.
- 5 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.
- Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium pharaonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.
- 10 Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Phthirus pubis.
- Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma infestans.
- 15 Die Anwendung im Bereich der Haushaltsinsektizide erfolgt allein oder in Kombination mit anderen geeigneten Wirkstoffen wie Phosphorsäureestern, Carbamaten, Pyrethroiden, Wachstumsregulatoren oder Wirkstoffen aus anderen bekannten Insektizidklassen.
- 20 Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gel- und Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäcken und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködern oder Köderstationen.
- 25

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Stoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

5

Synthese 1.Stufe:



(VIII-b-1)

10 Zu einer Mischung bestehend aus 100.5 g (0.50 mol) 4-Brombenzoesäure, 1 ml Dimethylformamid und 1200 ml Dichlormethan wird unter Rühren eine Lösung von 63.5 g (0.50 mol) Oxalylchlorid in 50 ml Dichlormethan zugetropft. Nach 4-stündigem Rühren und nach Beendigung der Gasentwicklung (HCl, CO, CO₂) kühlt man unter Argon auf -60°C und tropft innerhalb von 10 Minuten ein Gemisch aus 70.8 g (0.50 mol) 2-Chlorbenzylamin und 161.0 g (1.25 mol) N,N-Diisopropylethylamin

15 hinzu. Nach Rühren über Nacht wird die so erhaltene gelbe Lösung nacheinander dreimal mit je 250 ml 2N Salzsäure, einmal mit 300 ml Wasser und einmal mit 300 ml gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach Trocknen der organischen Phase über Natriumsulfat und vollständigem Einengen erhält man einen Rückstand, der mit 200 ml Dichlormethan bei Raumtemperatur aufgerührt und anschließend abgesaugt wird. Den so erhaltenen Rückstand nimmt man in 200 ml Methyl-

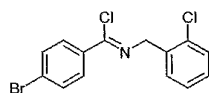
20 tert-butylether auf, erhitzt kurz zum Sieden, lässt Abkühlen und saugt erneut ab. Man erhält 108 g (83% der Theorie) 4-Brom-N-(2-chlorbenzyl)benzamid vom Schmelzpunkt 133°C.

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 74 -

Synthese 2. Stufe:



(II-b-1)

5 Eine Mischung aus 106.4 g (0.34 mol) der Verbindung (VIII-b-1) und 200 ml Thionylchlorid wird für 2 h zum Rückfluss erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur entfernt man das überschüssige Thionylchlorid unter vermindertem Druck. Das so erhaltene gelbe Öl kristallisiert nach kurzem Stehen bei Raumtemperatur.

Man erhält 112.5 g (97 % der Theorie) 4-Brom-N-(2-chlorbenzyl)phenylcarboximidoyl-chlorid vom Schmelzpunkt 58 bis 61°C.

10

Synthese 3. Stufe:

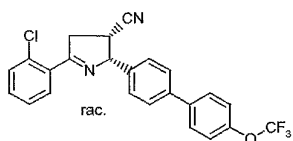
Eine Mischung aus 55.9 g (163 mmol) der Verbindung (II-b-1), 17.3 g (327 mmol) Acrylsäurenitril und 33.0 g (327 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man mit dreimal 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml Wasser und einmal mit 100 ml konzentrierter Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan chromatographiert.

20 Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2-chlorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrole-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 110°C.

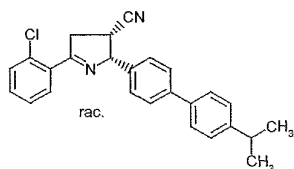
WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 75 -

Beispiel 2

- 5 Eine Mischung aus 0.997 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-1), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase
- 10 erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert-butylether ergibt einen weißen Feststoff.
- 15 Man erhält 320 mg (26% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 132°C.

Beispiel 3

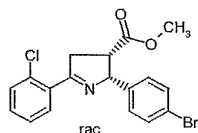
- 20 Eine Mischung aus 0.803 g (2.23 mmol) der Verbindung (I-b-1), 0.732 g (4.46 mmol) 4-Isopropyl-phenyl-boronsäure, 0.130 g (0.12 mmol) Tetrakis-tri-

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 76 -

- phenylphosphin-Palladium, 15 ml 1,2-Dimethoxyethan und 3.7 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 40 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Chromatographie des so erhaltenen Rückstandes an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigsäureethylester als Eluens ergibt das gewünschte Produkt.
- Man erhält 230 mg (26% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(isopropyl)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 127-128°C.

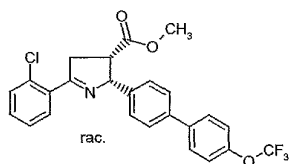
Beispiel 4

- Eine Mischung aus 55.9 g (163 mmol) der Verbindung (II-b-1), 28.1 g (327 mmol) Acrylsäuremethylester und 33.0 g (327 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man dreimal mit je 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml Wasser und einmal mit 100 ml Konz. Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan chromatographiert.
- Man erhält ((2S,3R), (2R,3S)-2-(4-Bromphenyl)-5-(2-chlorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrrol-3-carbonsäuremethylester vom Schmelzpunkt 134°C.

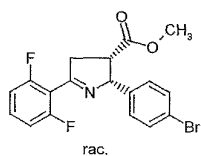
WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 77 -

Beispiel 5

- 5 Eine Mischung aus 1.09 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-2), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 prozentige Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase
- 10 erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Der Rückstand wird an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigsäureethylester als Eluens chromatographiert.
- Man erhält 620 mg (47% d. Th.) ((2S, 3R), (2R, 3S))-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester
- 15 als gelbliches Öl.
log P (pH 2.3) = 5.05.

Beispiel 6

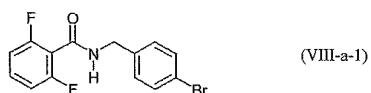
20

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

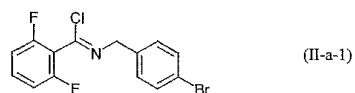
- 78 -

Synthese 1. Stufe:



- 5 Zu einer Lösung von 73.3 g (464 mmol) 2,6-Difluorbenzoesäure in 1000 ml Dichlormethan und 2 ml Dimethylformamid wird eine Lösung von 64.8 g (510 mmol) Oxalylchlorid in 200 ml Dichlormethan bei 20°C unter Argon zugetropft (1 h, Innentemperatur fällt ohne Argonstrom auf 15°C). Nach Ende der starken Gasentwicklung (CO₂, CO, HCl) wird auf 35°C erwärmt und 5 min nachgerührt. Anschließend gibt man 103.2 g (464 mmol) 4-Brombenzylaminhydrochlorid zu und tropft eine Lösung
- 10 von 140.5 g (1391 mmol) Triethylamin in 100 ml Dichlormethan bei 0°C zu der Lösung des Säurechlorids. Nach Beendigung der Reaktion gibt man 200 ml Dichlormethan zu. Dann wird zweimal mit je 500 ml 2N HCl, zweimal mit je 250 ml 2 N NaOH ausgeschüttelt, anschließend neutral gewaschen und einmal mit 100 ml konzentrierter Natriumchloridlösung extrahiert. Nach Trocknen über Natriumsulfat
- 15 wird filtriert und das Filtrat unter vermindertem Druck vollständig eingeeengt. Die gewünschte Verbindung kristallisiert aus Dichlormethan/n-Hexan.
- Man erhält 125.7 g (83 % d. Th.) N-(4-Brombenzyl)-2,6-difluorbenzamid vom Schmelzpunkt 142°C.

20 Synthese 2. Stufe:



- 25 25 g (76.7 mmol) der Verbindung (VIII-a-1) wird in 60 ml Thionylchlorid für 2 h unter Rückfluss erhitzt. Anschließend engt man unter vermindertem Druck vollständig ein.

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 79 -

Der so erhaltene Rückstand wird ohne weitere Reinigung für die Folgereaktionen eingesetzt.

Synthese 3. Stufe:

5

Eine Mischung von 25.4 g (73.7 mmol) der Verbindung (II-a-1), 25.3 g Acrylsäuremethylester (294 mmol) und 29.8 g (295 mmol) Triethylamin wird für 14 d unter Licht- und Luftausschluss stehen gelassen.

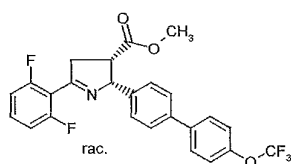
10

Zur Aufarbeitung nimmt man in 500 ml Dichlormethan auf und extrahiert die organische Phase dreimal mit je 500 ml 2N Salzsäure. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck eingengt und der so erhaltene Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Methanol als Laufmittel chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrol-3-carbonsäuremethylester vom Schmelzpunkt 133°C.

15

Beispiel 7



Eine Mischung aus 1.10 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-3), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natriumcarbonatlösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollstän-

WO 02/24646

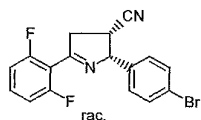
PCT/EP01/10422

- 80 -

dig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert-butylether ergibt einen weißen Feststoff.

Man erhält 480 mg (39% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-Difluorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester vom Schmelzpunkt 125°C.

Beispiel 8



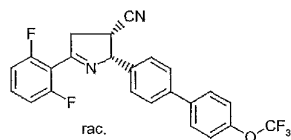
10 Eine Mischung aus 25.4 g (76.6 mmol) der Verbindung (II-a-1), 16.2 g (303 mmol) Acrylsäurenitril und 30.7 g (303 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man dreimal mit je 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml

15 Wasser und einmal mit 100 ml konzentrierter Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan als Eluens chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 159°C.

20

Beispiel 9



WO 02/24646

PCT/EP01/10422

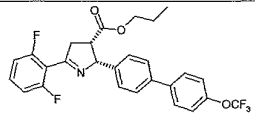
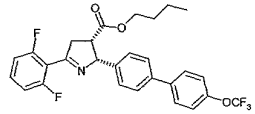
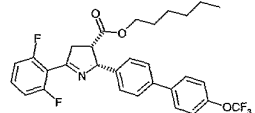
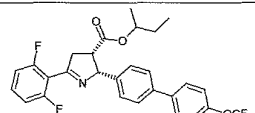
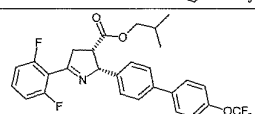
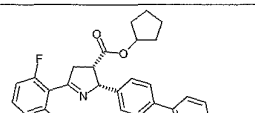
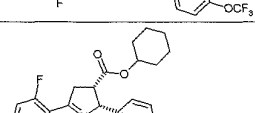
- 81 -

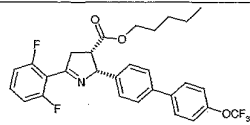
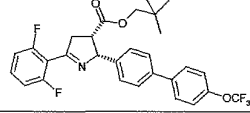
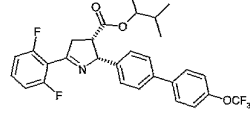
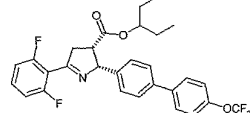
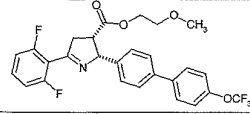
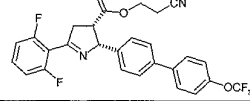
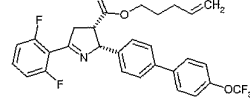
- Eine Mischung aus 1.00 g (2.78 mmol) der Verbindung (1-b-4), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert-butylether ergibt einen hellgelben Feststoff.
- Man erhält 520 mg (42% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-Difluorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt: 145°C.

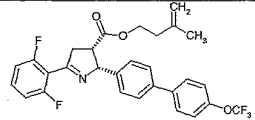
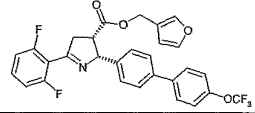
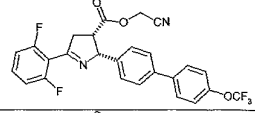
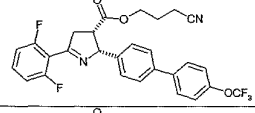
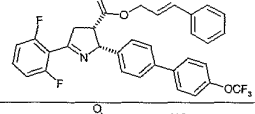
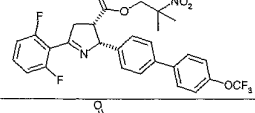
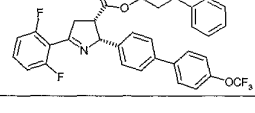
15

Die in der folgenden Tabelle aufgeführten Verbindungen können entsprechend einem der oben beschriebenen erfindungsgemäßen Verfahren hergestellt werden.

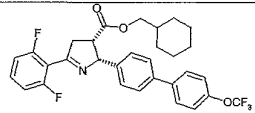
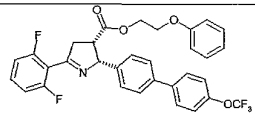
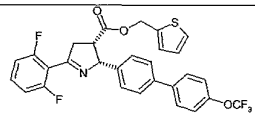
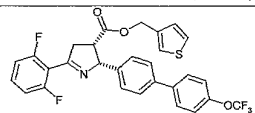
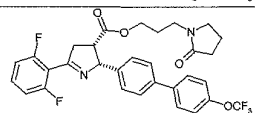
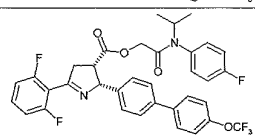
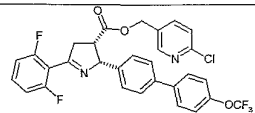
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
10		4.73 ^{a)}	
11		3.35 ^{a)}	
12		5.05 ^{a)}	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
13			
14		5,41 ^{a)} 5,49 ^{b)}	
15		6,11 ^{a)} 6,18 ^{b)}	
16		5,40 ^{a)} 5,48 ^{b)}	
17		5,38 ^{a)} 5,47 ^{b)}	
18		5,47 ^{a)} 5,54 ^{b)}	
19		5,85 ^{a)} 5,91 ^{b)}	

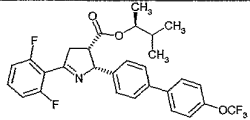
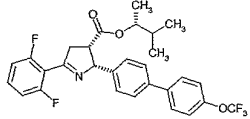
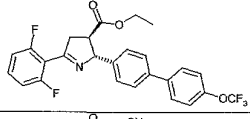
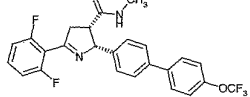
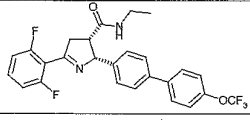
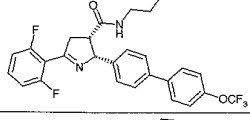
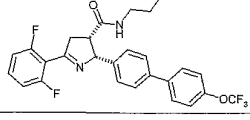
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
20		5,84 ^{a)}	
21		5,78 ^{a)}	
22		5,71 ^{a)}	
23		5,78 ^{a)}	
24		4,37 ^{a)}	
25		4,08 ^{a)}	
26		5,48 ^{a)}	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
27		5,48 ^{a)}	
28		4,87 ^{a)}	
29		4,23 ^{a)}	
30		4,18 ^{a)}	
31		5,55 ^{a)}	
32		4,77 ^{a)}	
33		5,78 ^{a)}	

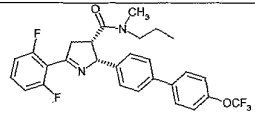
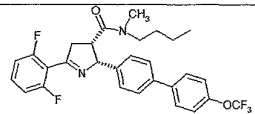
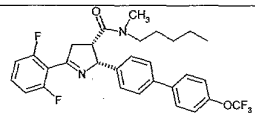
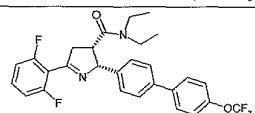
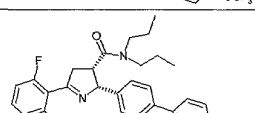
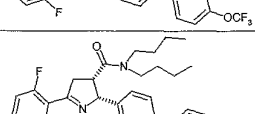
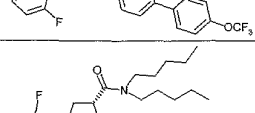
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
34		5,31 ^{a)}	
35		5,65 ^{a)}	
36		5,58 ^{a)}	
37			
38		5,54 ^{a)}	
39		4,67 ^{a)}	
40		4,67 ^{a)}	

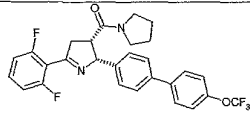
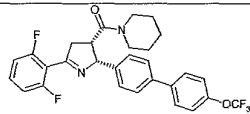
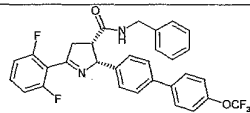
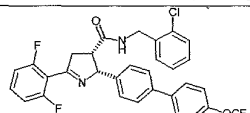
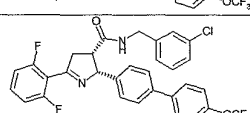
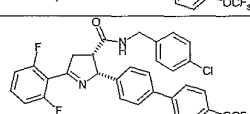
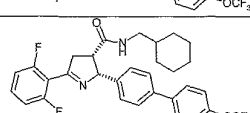
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
41		6,28 ^{a)}	
42		5,21 ^{a)}	
43		5,19 ^{a)}	
44		5,14 ^{a)}	
45		3,72 ^{a)}	
46		4,98 ^{a)}	
47		4,82 ^{a)}	

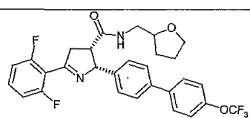
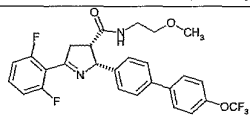
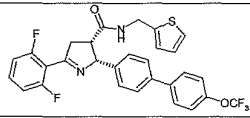
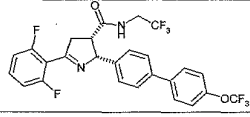
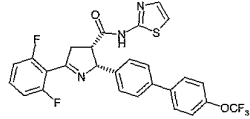
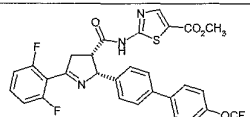
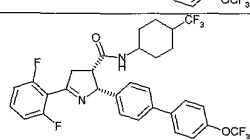
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
48		6,22 ^{a)}	
49		6,28 ^{a)}	
50		6,54 ^{a)}	
51		5,97 ^{a)}	
52		5,71 ^{a)}	
53		4,13 ^{a)}	
54		3,59 ^{a)}	

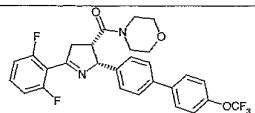
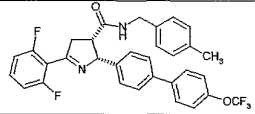
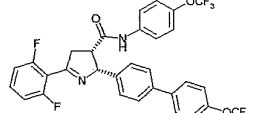
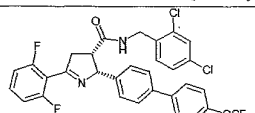
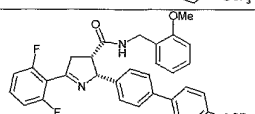
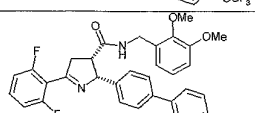
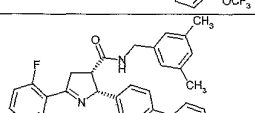
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
55		5,74 ^{a)} 5,77 ^{b)}	
56		5,65 ^{a)} 5,68 ^{b)}	
57			
58		3,26 ^{a)}	
59		3,49 ^{a)}	
60		3,78 ^{a)}	
61		4,03 ^{a)}	

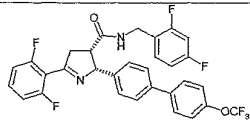
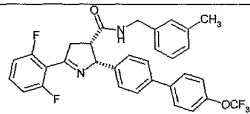
Nr.	Struktur	LogP	Fp/ ^o C
62		4,37 ^{a)}	
63		4,67 ^{a)}	
64		3,74 ^{a)}	
65		4,23 ^{a)}	
66		4,37 ^{a)}	
67		3,61 ^{a)}	
68		3,90 ^{a)}	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
69		4,23 ^{a)}	
70		4,56 ^{a)}	
71		4,92 ^{a)}	
72		4,18 ^{a)}	
73		4,92 ^{a)}	
74		5,65 ^{a)}	
75		6,43 ^{a)}	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
76		3,82 ^{a)}	
77		4,32 ^{a)}	
78		3,94 ^{a)}	
79		4,46 ^{a)}	
80		4,46 ^{a)}	
81		4,41 ^{a)}	
82		4,67 ^{a)}	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
83		3,49 ^{a)}	
84		3,33 ^{a)}	
85		4,03 ^{a)}	
86		3,94 ^{a)}	
87		3,78 ^{a)}	
88		3,94 ^{a)}	
89		4,46 ^{a)}	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
90		3,49 ^{a)}	
91		4,37 ^{a)}	
92		4,87 ^{a)}	
93		4,87 ^{a)}	
94		4,18 ^{a)}	
95		4,03 ^{a)}	
96		4,72 ^{a)}	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
97		4,23 ^{a)}	
98		4,41 ^{a)}	

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

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 90% Acetonitril (in der Tabelle mit ^{a)} markiert).

Die Bestimmung erfolgt im neutralen Bereich bei pH 7.5 mit 0,01-molare wässriger Phosphatpuffer-Lösung und Acetonitril als Eluenten; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril (in der Tabelle mit ^{b)} markiert).

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 aufeinanderfolgenden Alkanonen).

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

AnwendungsbeispieleBeispiel A5 **Liriomyza-Test**

Lösungsmittel: 3 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

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

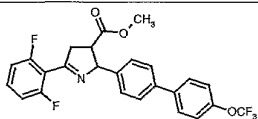
- 15 Bohnenpflanzen (*Phaseolus vulgaris*), die von Eiern und Entwicklungsstadien der Thripse (*Liriomyza trifolii*) befallen sind, werden in eine Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration getaucht.

- 20 Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Thripse abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Thripse abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

25

Tabelle A: Liromyza-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100

Beispiel B**Meloidogyne-Test**

- 5 Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

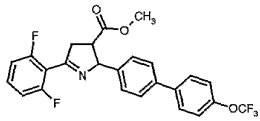
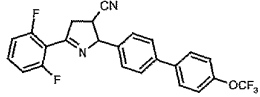
- Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Ge-
wichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und
10 verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzen-
tration.

- Gefäße werden mit Sand, Wirkstofflösung, Meloidogyne incognita-Ei-Larvensuspension und Salatsamen gefüllt. Die Salatsamen keimen und die Pflänzchen entwickeln
15 sich. An den Wurzeln entwickeln sich die Gallen.

- Nach der gewünschten Zeit wird die nematizide Wirkung an Hand der Gallenbildung
in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass keine Gallen gefunden wurden; 0% be-
deutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der der unbehandelten
20 Kontrolle entspricht.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle B: Meloidogyne-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 Tagen
	20	100
	20	90

Beispiel C**Phaedon-Larven-Test**

- 5 Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

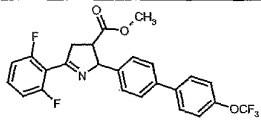
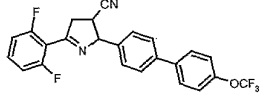
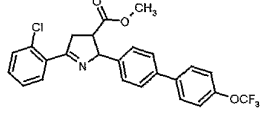
- 10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

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

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

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle C: Phaeton-Larven-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Beispiel D**Spodoptera frugiperda-Test**

- 5 Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

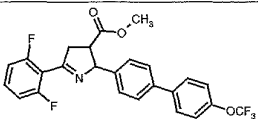
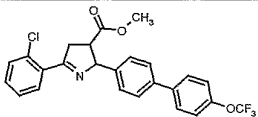
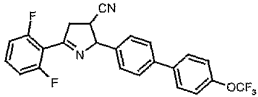
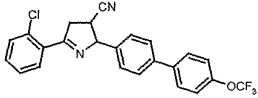
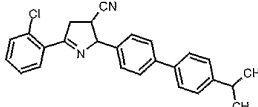
 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Ge-
 wichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und
10 verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzen-
 tration.

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

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

20 Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgen-
 den Tabelle hervor.

Tabelle D: Spodoptera frugiperda -Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Beispiel E**Diabrotica balteata – Test (Larven im Boden)**

Grenzkonzentrations-Test / Bodeninsekten - Behandlung transgener Pflanzen

5

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Die Wirkstoffzubereitung wird auf den Boden gegossen. Dabei spielt die Konzentration des Wirkstoffs in der Zubereitung praktisch keine Rolle, entscheidend ist allein die Wirkstoffgewichtsmenge pro Volumeneinheit Boden, welche in ppm (mg/l) angegeben wird. Man füllt den Boden in 0,25 l Töpfe und lässt diese bei 20°C stehen.

20

Sofort nach dem Ansatz werden je Topf 5 vorgekeimte Maiskörner der Sorte YIELD GUARD (Warenzeichen von Monsanto Comp., USA) gelegt. Nach 2 Tagen werden in den behandelten Boden die entsprechenden Testinsekten gesetzt. Nach weiteren 7 Tagen wird der Wirkungsgrad des Wirkstoffs durch Auszählen der aufgelaufenen Maispflanzen bestimmt (1 Pflanze = 20 % Wirkung).

25

Beispiel F**Heliothis virescens - Test** (Behandlung transgener Pflanzen)

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

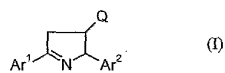
10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Sojatriebe (Glycine max) der Sorte Roundup Ready (Warenzeichen der Monsanto Comp. USA) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit der Tabakknospentraupe *Heliothis virescens* besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

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

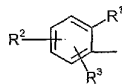
Patentansprüche

1. Δ^1 -Pyrroline der Formel (I)



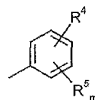
in welcher

Ar¹ für den Rest



steht und

Ar² für den Rest



steht, in denen

m für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

R¹ für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, $-S(O)_6R^6$, $-NR^7R^8$ steht,

R² und R³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, $-S(O)_6R^6$, $-NR^7R^8$ stehen,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 106 -

- R⁴ für Halogen oder eine der folgenden Gruppierungen
 (l) -X-A
 (m) -B-Z-D
 (n) -Y-E
 5 steht,
- R⁵ für Halogen, Hydroxy, Cyano, -CONH₂, -CSNH₂, Nitro, Alkyl,
 Alkylcarbonyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkyl-
 sulfonyloxy, Trialkylsilyl, Alkoxy carbonyl, -CONR⁷R⁸,
 10 -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)_nR⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶, Halogenalkylamino-
 sulfonyl, Bisalkoxyboran, -B(OH)₂ steht,
- X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)_n, -NR⁶, Carbonyl, Carbo-
 nyloxy, Oxy carbonyl, Oxy sulfonyl (OSO₂), Alkyl, Alkenyl,
 15 Alkyl, Alkyl, Alkyl, Alkyl, Alkyl, Alkyl, Alkyl, Alkyl,
 Cyclopropyl, Oxiranylen steht,
- A für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der
 Liste W¹ substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl
 20 oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der
 Liste W² substituiertes 5- bis 10-gliedriges, gesättigtes oder ungesät-
 tigtetes Heterocycl mit einem oder mehreren Heteroatomen aus der
 Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 25 B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste
 W¹ substituiertes p-Phenyl steht,
- Z für -(CH₂)_n, Sauerstoff oder -S(O)_n steht,
- 30 D für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkyl, Halogenalkyl, Halogenalk-
 enyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

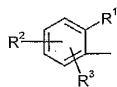
- 107 -

- Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-\text{SO}_2$ -, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylenoxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Halogenalkylen, Halogenalkenylen steht,
- 5 E für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,
- 10 W¹ für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Pentafluorothio, $-\text{S}(\text{O})_6\text{R}^6$, $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{OSO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{OSO}_2\text{N}(\text{R}^6)\text{CO}_2\text{R}^6$, $-\text{OSO}_2\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{R}^6)=\text{N}-\text{O}(\text{R}^6)$ steht,
- 15 W² für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, $-\text{S}(\text{O})_6\text{R}^6$, $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{OSO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{R}^6)=\text{N}-\text{O}(\text{R}^6)$ steht,
- 20 n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,
- Q für $-\text{CO}_2\text{R}^9$, $-\text{COR}^{10}$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, $-\text{CN}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CSNH}_2$, $-\text{S}(\text{O})_6\text{R}^6$, $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{PO}(\text{OR}^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 25 Q außerdem für $-\text{CO}_2\text{R}^{13}$ oder $-\text{CONR}^{14}\text{R}^{15}$ steht,
- o für 0, 1 oder 2 steht,
- 30 R⁶ für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

- R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,
- 5 R⁹ für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Aralkyl, Phenyl steht,
- R¹⁰ für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl steht,
- 10 R¹¹ für Alkyl, Aryl steht,
- R¹² für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl oder Aryl steht,
- 15 R¹³ für Wasserstoff; für einfach oder mehrfach substituiertes Alkyl; für gegebenenfalls substituiertes Aminocarbonylalkyl; für Alkenyl, Phenylalkenyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl oder Phenoxyalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl; für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; für Tetrahydro-
- 20 naphthyl oder Indanyl steht,
- R¹⁴ und R¹⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogenalkyl, Alkoxyalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenylalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes, jeweils gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1
- 25 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel stehen,
- 30 R¹⁴ und R¹⁵ außerdem gemeinsam für Alkylenoxyalkylen oder Alkylenthioalkylen stehen.

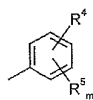
2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar¹ für den Rest



5 steht und

Ar² für den Rest



steht, worin

10

m für 0, 1, 2 oder 3 steht,

R¹ für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸ steht,

15

R² und R³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸ stehen,

20

R⁴ für Fluor, Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindliche Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

25

steht,

- 5 R⁵ für Halogen, Hydroxy, Cyano, -CONH₂, -CSNH₂, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyloxy, Tri(C₁-C₆-alkyl)-silyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, -CONR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)₀R⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶, (C₁-C₆-Halogenalkyl)aminosulfonyl, Bis(C₁-C₆-alkoxy)boran, -B(OH)₂ steht,
- 10 X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)₀, -NR⁶, Carbonyl, Carbo-nyloxy, Oxy carbonyl, Oxy sulfonyl (OSO₂), C₁-C₄-Alkylen, C₂-C₄-Alkenylen, C₂-C₄-Alkinylen, C₁-C₄-Alkylenoxy, C₁-C₄-Oxyalkylen, C₁-C₄-Oxyalkylenoxy, C₁-C₄-Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxira-nylen steht,
- 15 A für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W² substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefel-
- 20 atomen (insbesondere Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzo-thienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl, Chinolinyll oder Isochinolinyll) steht,
- 25 B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes p-Phenylen steht,
- Z für -(CH₂)_n-, Sauerstoff oder -S(O)₀- steht,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 111 -

- D für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl steht,
- 5 Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂-, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylen, C₂-C₆-Alkenylen, C₂-C₆-Alkinylen, C₁-C₆-Halogenalkylen, C₂-C₆-Halogenalkenylen, C₁-C₄-Alkylenoxy, C₁-C₄-Oxyalkylen, C₁-C₄-Oxyalkylenoxy, C₁-C₄-Thioalkylen steht,
- 10 E für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl steht,
- 15 W¹ für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, Tri(C₁-C₄-alkyl)silyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, -S(O)₆R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -OSO₂N(R⁶)CO₂R⁶, -OSO₂R¹², -C(R⁶)=N-O(R⁶) steht,
- 20 W² für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, Tri(C₁-C₄-alkyl)silyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, (C₁-C₆-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, -S(O)₆R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -C(R⁶)=N-O(R⁶) steht,
- 25 n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,
- 30 Q für -CO₂R⁹, -COR¹⁰, -CONR⁷R⁸, -CN, -CONH₂, -CSNH₂, -S(O)₆R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -PO(OR¹¹)₂, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder

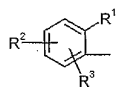
ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

- 5 Q außerdem für $-\text{CO}_2\text{R}^{13}$ oder $-\text{CONR}^{14}\text{R}^{15}$ steht,
- o für 0, 1 oder 2 steht,
- R⁶ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl steht,
- 10 R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,
- R⁹ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Benzyl, Phenyl steht,
- 15 R¹⁰ für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Benzyl steht,
- R¹¹ für C₁-C₆-Alkyl, Phenyl steht,
- 20 R¹² für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Benzyl oder Phenyl steht,
- R¹³ für Wasserstoff; für einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl oder 2-Pyrrolidinon substituiertes C₁-C₆-Alkyl; für Aminocarbonyl-C₁-C₆-alkyl, welches an der Aminogruppe gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl, Phenyl oder Halogenphenyl substituiert sein kann; für C₂-C₈-Alkenyl, Phenyl-C₂-C₆-alkenyl; für Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenoxy-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiert sein können; für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im
- 25
- 30

- Cycloalkylring einfach bis dreifach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können; für 5- oder 6-gliedriges gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Furyl, Thienyl, Pyridinyl, Furfuryl, Thenyl oder Pyridinylmethyl), wobei der Heterocyclus jeweils durch Halogen substituiert sein kann; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl steht,
- 5 R¹⁴ und R¹⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl; für Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiert sein können; für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiert sein können; für 5- oder 6-gliedriges gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Furyl, Thienyl, Tetrahydrofuryl, Furfuryl, Thenyl, Tetrahydrofurylmethyl, Thiazolyl), wobei der Heterocyclus jeweils durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiert sein kann stehen,
- 10 15 20 25
- R¹⁴ und R¹⁵ außerdem gemeinsam für C₁-C₄-Alkylendioxy-C₁-C₄-alkylen oder C₁-C₄-Alkylenthio-C₁-C₄-alkylen stehen.

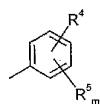
3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar¹ für den Rest



5 steht und

Ar² für den Rest



steht, in welchen

10

m für 0, 1 oder 2 steht,

R¹ für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

15

R² und R³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy stehen,

20

R⁴ für Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindlichen Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

25

steht,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 115 -

- 5 R⁵ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, -CONH₂, -CSNH₂, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy, -OSO₂CF₃, -CONR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)₆R⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶, -B(OH)₂, 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan) steht,
- 10 X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂-, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxsulfonyl (OSO₂), C₁-C₄-Alkylen, C₂-C₄-Alkenylen, C₂-C₄-Alkinylen, C₁-C₄-Alkylenoxy, C₁-C₄-Oxyalkylen, C₁-C₄-Oxyalkylenoxy, C₁-C₄-Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen steht,
- 15 A für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W² substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl) steht,
- 20 B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes p-Phenylen steht,
- Z für -(CH₂)_n-, Sauerstoff oder -S(O)₆- steht,

- D für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, Di(C₁-C₄-Alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl steht,
- 5 Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂-, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl; jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl; C₁-C₄-Alkylenoxy, C₁-C₄-Oxyalkyl, C₁-C₄-Oxyalkylenoxy, C₁-C₄-Thioalkyl steht,
- 10 E für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl steht,
- 15 W¹ für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Formyl, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, (C₁-C₄-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, -S(O)₀R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -OSO₂R¹², -C(R⁶)=N-O(R⁶) steht,
- 20 W² für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, -OSO₂CF₃, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, -S(O)₀R⁶, -SO₂NR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -C(R⁶)=N-O(R⁶) steht,
- 25 n für 0, 1, 2 oder 3 steht,
- 30 Q für -CO₂R⁹, -COR¹⁰, -CONR⁷R⁸, -CN, -PO(OR¹¹)₂, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 117 -

Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel (insbesondere Dihydrodioxazin, Oxazolin, Thiazolin, Imidazolin, Tetrazol) steht,

- 5 Q außerdem für $-\text{CO}_2\text{R}^{13}$ oder $-\text{CONR}^{14}\text{R}^{15}$ steht,
- o für 0, 1 oder 2 steht,
- 10 R⁶ für C₁-C₆-Alkyl oder jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl steht,
- R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, oder gemeinsam für C₄-C₅-Alkylen stehen,
- 15 R⁹ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Benzyl, Phenyl steht,
- 20 R¹⁰ für C₁-C₆-Alkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkyl steht,
- R¹¹ für C₁-C₄-Alkyl, Phenyl steht,
- 25 R¹² für C₁-C₄-Alkyl oder für durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl steht,
- 30 R¹³ für Wasserstoff, für einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Cyano, Nitro, Methoxy, Methoxycarbonyl oder 2-Pyrrolidinon substituiertes C₁-C₄-Alkyl; für Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, welches an der Aminogruppe gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl, Phenyl oder Halogenphenyl substituiert sein kann; für C₂-C₆-Alkenyl,

Phenyl-C₂-C₅-alkenyl; für Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenoxy-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach durch Methyl substituiert sein können; für Furyl, Thienyl, Pyridinyl, Furfuryl, Thenyl oder Pyridinylmethyl, welche jeweils im Heterocyclus durch Chlor substituiert sein können; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl steht,

10

R¹⁴ für Wasserstoff steht,

15

R¹⁵ für C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl; für Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für Furyl, Thienyl, Tetrahydrofuryl, Furfuryl, Thenyl, Tetrahydrofurylmethyl, Thiazolyl oder durch C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Thiazolyl steht,

20

R¹⁴ und R¹⁵ außerdem gemeinsam für Morpholino oder Thiomorpholino stehen.

25

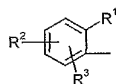
4. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar¹ für den Rest

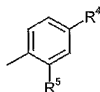
WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 119 -



steht und

Ar² für den Rest

5

steht, in welchen

10

R¹ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy steht,

15

R² und R³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy stehen,

20

R⁴ für Chlor, Brom oder eine der folgenden Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

25

R⁵ für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Trifluormethylthio, -OSO₂CF₃, -OSO₂NMe₂ oder -SO₂CF₃ steht,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 120 -

- R⁵ außerdem für Wasserstoff steht,
- X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂-, Carbonyl, -CH₂-, -(CH₂)₂-, -CH=CH- (E oder Z), -C≡C-, -CH₂O-, -(CH₂)₂O-, -OCH₂-, -SCH₂-, -S(CH₂)₂-, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O- steht,
- A für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes Phenyl, oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W² substituiertes Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazolyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl steht,
- B für gegebenenfalls einfach durch Reste aus der Liste W¹ substituiertes p-Phenylen steht,
- Z für Sauerstoff, Schwefel oder -SO₂- steht,
- D für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, -CF₃, -CHF₂, -CClF₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, -SO₂CF₃, -SO₂(CF₂)₃CF₃, -SO₂NMe₂ steht,
- Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, -SO₂-, Carbonyl, -CH₂-, -(CH₂)₂-, -CH=CH- (E oder Z), -C≡C-, -CH₂O-, -(CH₂)₂O-, -OCH₂-, -SCH₂-, -S(CH₂)₂-, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O- steht,
- E für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, -CF₃, -CHF₂, -CClF₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 121 -

-CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃,
-SO₂CF₃, -SO₂(CF₂)₃CF₃, -SO₂NMe₂ steht,

- 5 W¹ für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, -CF₃, -CHF₂, -CClF₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -OCH₂CF₃, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, -SCF₃,
10 -SCHF₂, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -SO₂NMe₂, -OSO₂CH₃, -OSO₂CF₃, -OSO₂(CF₂)₃CF₃, -COCH₃, -CO₂CH₃, -CO₂Et, -SO₂Me, -OSO₂NMe₂, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe steht,
- 15 W² für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethylthio, -OSO₂CF₃, -COCH₃, -CO₂CH₃, -OCH₂CF₃, -SO₂CF₃, -SO₂NMe₂, -OSO₂NMe₂, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe steht,
- 20 Q für -CO₂CH₃, -CO₂CH₂CH₃, -CO₂-n-Propyl, -CO₂-Isopropyl, -CO₂-n-Butyl, -CO₂-Isobutyl, -CO₂-sec-Butyl, -CO₂-tert-Butyl, -CO₂-n-Pentyl, -CO₂-Neopentyl, -CO₂-sec-Isoamyl, -CO₂-Pentan-3-yl, -CO₂-Cyclopentyl, -CO₂-n-Hexyl, -CO₂-Cyclohexyl, -CO₂-Trifluorethyl, -CO₂CH₂Ph, -CO₂Ph, -COCH₃, -COCH₂CH₃, -CO-n-Propyl,
25 -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), -CONMe₂, -CONEt₂, -CON(n-Propyl)₂, -CON(Isopropyl)₂, -CON(n-Butyl)₂, -CON(n-Pentyl)₂, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl,
30 -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, -PO(OMe)₂, Pyrrolidi-

nocarbonyl, Piperidinocarbonyl, $-\text{PO}(\text{OEt})_2$, $-\text{PO}(\text{OPh})_2$, Dihydrodi-
oxacetyl, Oxazolyl, Thiazolyl, Imidazolyl, Tetrazolyl steht,

Q außerdem für $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CN}$, $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CN}$, $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CN}$,
5 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NO}_2$, $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$, $-\text{CO}_2\text{H}$, 2-Methoxycarbo-
nyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl,
N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethylloxycarbonyl,
 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$,
10 $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-\text{Ph}$, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxy-
carbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethylloxycarbonyl, 3-
Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethylloxycarbonyl, 4-Methyl-
cyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethylloxycarbonyl, 1-Cyclo-
hexylethylloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyloxycarbonyl,
15 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethylloxycarbonyl, 3-Pyridinyl-
methylloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethylloxycarbonyl, 1-Tetra-
hydronaphthylloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, $-\text{CON}(\text{H})\text{CH}_2\text{CF}_3$,
Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbo-
nyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlor-
20 benzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methyl-
benzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlor-
benzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimeth-
oxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-
Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocar-
bonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenyl-aminocarbonyl, 2-
25 Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-aminocarbonyl, 5-
Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholino-
carbonyl steht,

5. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen
30

Ar^1 für den Rest

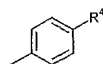
WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 123 -



steht,

Ar² für den Rest

steht,

R¹ für Fluor oder Chlor steht,R² für Wasserstoff, Chlor oder Fluor steht,R⁴ für -B-Z-D steht,

B für p-Phenylen steht,

Z für Sauerstoff oder Schwefel steht,

D für -CF₃ steht,

Q für -CO₂CH₃, -CO₂CH₂CH₃, -CO₂-n-Propyl, -CO₂-Isopropyl, -CO₂-n-Butyl, -CO₂-Isobutyl, -CO₂-sec-Butyl, -CO₂-tert-Butyl, -CO₂-n-Pentyl, -CO₂-Neopentyl, -CO₂-sec-Isoamyl, -CO₂-Pentan-3-yl, -CO₂-Cyclopentyl, -CO₂-n-Hexyl, -CO₂-Cyclohexyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH-Cyclohexyl, -CONMe₂, -CONEt₂, -CON(n-Propyl)₂, -CON(Isopropyl)₂, -CON(n-Butyl)₂, -CON(n-Pentyl)₂, -CON(Me)Et,

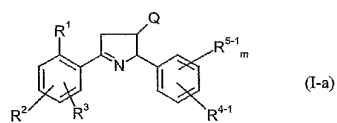
-CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl steht,

- Q außerdem für -CO₂H, -CO₂CH₂CN, -CO₂(CH₂)₂CN, 5
-CO₂(CH₂)₃CN, -CO₂CH₂C(CH₃)₂NO₂, -CO₂(CH₂)₂OCH₃, 2-Methoxycarbonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethyloxycarbonyl, -CO₂(CH₂)₃CH=CH₂, -CO₂(CH₂)₂C(CH₃)=CH₂,
-CO₂CH₂CH=CH-Ph, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxycarbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethyloxycarbonyl, 10
3-Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethyloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethyloxycarbonyl, 1-Cyclohexylethyloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyloxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethyloxycarbonyl, 1-Tetrahydronaphthylloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, -CON(H)CH₂CF₃, Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbonyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenyl-aminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-aminocarbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl steht.

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 125 -

6. Δ^1 -Pyrroline der Formel (I-a)

in welcher

5

R^1 , R^2 , R^3 , Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

R^{4-1} für A oder B-Z-D

10

steht, wobei

A, B, Z und D die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

15

und

R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, $-\text{OSO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{S(O)}_o\text{R}^6$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NHCO}_2\text{R}^6$, Haloalkylamino-sulfonyl steht,

20

wobei

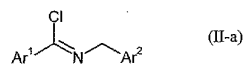
25

R^6 , R^7 , R^8 und o die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben.

7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet,

A-1.) dass man Iminochloride der Formel (II-a)

5



mit Dipolarophilen der Formel (III)



10

in welchen

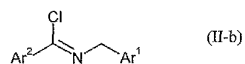
Ar¹, Ar², und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

15

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

A-2.) dass man Iminochloride der Formel (II-b)

20



mit Dipolarophilen der Formel (III)



25

in welchen

WO 02/24646

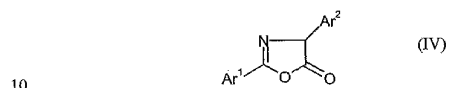
PCT/EP01/10422

- 127 -

Ar¹, Ar², und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

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

B.) dass man Oxazolinone der Formel (IV)



mit Dipolarophilen der Formel (III)

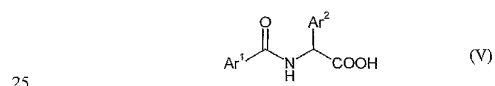


in welchen

Ar¹, Ar², und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

20 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

C.) dass man Carbonsäuren der Formel (V)



WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 128 -

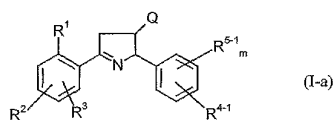
mit Dipolarophilen der Formel (III)



5 in welchen

Ar¹, Ar², und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

10 in Gegenwart von Essigsäureanhydrid und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

D.) dass man Δ^1 -Pyrroline der Formel (I-a)

15

in welcher

20 R¹, R², R³, Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

R⁴⁻¹ für A oder B-Z-D

25

steht, wobei

A, B, Z und D die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

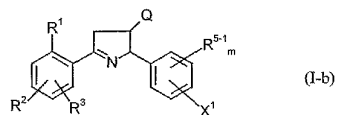
- 129 -

und

5 R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogen-
alkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl,
-CONR⁷R⁸, -OSO₂NR⁷R⁸, -S(O)₆R⁶, -NR⁷R⁸, -NHCO₂R⁶,
Haloalkylaminosulfonyl steht,
wobei

10 R^6 , R^7 , R^8 und o die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeu-
tungen haben,

erhält, indem man Verbindungen der Formel (I-b)

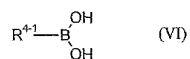


15 in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^{5-1} , Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen
Bedeutungen haben und

20 X^1 für Cl, Br, I, -OSO₂CF₃ steht

mit Boronsäuren der Formel (VI)



25 in welcher

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 130 -

R⁴⁻¹ die in diesem Anspruch angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines
Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdün-
nungsmittels umsetzt

oder

dass man Verbindungen der Formel (I-a) erhält, indem man Verbindungen der Formel (I-b)

in welcher

X¹ für 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan) steht

mit (Hetero)cyclen der Formel (VII)

T—A (VII)

in welcher A die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebene Bedeutung hat
und

T für Cl, Br, I, -OSO₂CF₃ steht,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines
Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdün-
nungsmittels umsetzt.

8. Schädlingbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

WO 02/24646

PCT/EP01/10422

- 131 -

9. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 zur Bekämpfung von Schädlingen.
- 5 10. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.
- 10 11. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
12. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln.

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter- national Application No PCT/EP 01/10422	
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 C07D07/22 C07D207/26 C07D409/14 C07D401/14 C07D405/14 C07D417/14 A01N43/36	
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC	
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 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, WPI Data, CHEM ABS Data	
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages Relevant to claim No.
A	WO 99 59968 A (ERDELEN CHRISTOPH ;BAYER AG (DE); GRAFF ALAN (DE); KRAATZ UDO (DE)) 25 November 1999 (1999-11-25) cited in the application claims 8-12; table 1 1,8
A	WO 98 22438 A (ERDELEN CHRISTOPH ;KLEEFELD GERD (DE); BAYER AG (DE); MENCKE NORBE) 28 May 1998 (1998-05-28) cited in the application claims 9-13; table 1 1,8
A	WO 99 59967 A (ERDELEN CHRISTOPH ;BACKHAUS DIRK (DE); BAYER AG (DE); MENCKE NORBE) 25 November 1999 (1999-11-25) cited in the application claims 8-12; table 1 1,8 -/-
☒ Further documents are listed in the continuation of box C. ☒ Patent family members are listed in annex.	
* Special categories of cited documents: *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art *S* document member of the same patent family	
Date of the actual completion of the international search 3 January 2002	Date of mailing of the international search report 15/01/2002
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Palatinlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-2016	Authorized officer Seitner, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No. PCT/EP 01/10422		
C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 183 217 A (CIBA GEIGY AG) 4 June 1986 (1986-06-04) claims 1,21-29	1,8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
 Information on patent family members

 International Application No.
 PCT/EP 01/10422

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9959968 A	25-11-1999	DE 19822247 A1	25-11-1999
		AU 4138499 A	06-12-1999
		BR 9910539 A	16-01-2001
		CN 1309636 T	22-08-2001
		WO 9959968 A1	25-11-1999
		EP 1080072 A1	07-03-2001
		HU 0102615 A2	28-11-2001
WO 9822438 A	28-05-1998	DE 19648011 A1	28-05-1998
		AU 737059 B2	09-08-2001
		AU 5319798 A	10-06-1998
		BR 9713520 A	21-03-2000
		CN 1244860 A	16-02-2000
		WO 9822438 A1	28-05-1998
		EP 0942901 A1	22-09-1999
		HU 0000437 A2	28-06-2000
		JP 2001506592 T	22-05-2001
		PL 333268 A1	22-11-1999
		TR 9901601 T2	21-09-1999
		US 6274613 B1	14-08-2001
WO 9959967 A	25-11-1999	DE 19822245 A1	25-11-1999
		AU 4036999 A	06-12-1999
		BR 9910540 A	30-01-2001
		WO 9959967 A1	25-11-1999
		EP 1077938 A1	28-02-2001
EP 0183217 A	04-06-1986	AT 53574 T	15-06-1990
		AU 612838 B2	18-07-1991
		AU 3491489 A	07-09-1989
		AU 586653 B2	20-07-1989
		AU 5039685 A	05-06-1986
		CA 1253509 A1	02-05-1989
		CA 1256884 A2	04-07-1989
		CA 1256869 A2	04-07-1989
		DE 3578171 D1	19-07-1990
		EP 0183217 A1	04-06-1986
		IL 88372 A	10-06-1990
		JP 61137858 A	25-06-1986
		US 4778901 A	18-10-1988
		US 4687861 A	18-08-1987
		ZA 8509068 A	30-07-1986

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Interj nales Aktenzeichen PC1/EP 01/10422		
A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 C07D207/22 C07D207/26 C07D409/14 C07D401/14 C07D405/14 C07D417/14 A01N43/36		
Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchierte(r) Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 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, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Bez. Anspruch Nr.
A	WO 99 59968 A (ERDELEN CHRISTOPH ;BAYER AG (DE); GRAFF ALAN (DE); KRAATZ UDO (DE)) 25. November 1999 (1999-11-25) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 8-12; Tabelle 1	1,8
A	WO 98 22438 A (ERDELEN CHRISTOPH ;KLEEFELD GERD (DE); BAYER AG (DE); MENCKE NORBE) 28. Mai 1998 (1998-05-28) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 9-13; Tabelle 1	1,8
A	WO 99 59967 A (ERDELEN CHRISTOPH ;BACKHAUS DIRK (DE); BAYER AG (DE); MENCKE NORBE) 25. November 1999 (1999-11-25) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 8-12; Tabelle 1 -/-	1,8
☒ 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 in 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 erfindeterischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindeterischer 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 offensichtlich ist *S* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 3. Januar 2002		Abschlußdatum des internationalen Recherchenberichts 15/01/2002
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5618 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 240-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 240-3016		Bevollmächtigter Beauftragter Seitner, I

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

		Internationales Aktenzeichen PCI/EP 01/10422
C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 183 217 A (CIBA GEIGY AG) 4. Juni 1986 (1986-06-04) Ansprüche 1, 21-29	1, 8

INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 01/10422

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9959968 A	25-11-1999	DE 19822247 A1	25-11-1999
		AU 4138499 A	06-12-1999
		BR 9910539 A	16-01-2001
		CN 1309636 T	22-08-2001
		WO 9959968 A1	25-11-1999
		EP 1080072 A1	07-03-2001
		HU 0102615 A2	28-11-2001
WO 9822438 A	28-05-1998	DE 19648011 A1	28-05-1998
		AU 737059 B2	09-08-2001
		AU 5319798 A	10-06-1998
		BR 9713520 A	21-03-2000
		CN 1244860 A	16-02-2000
		WO 9822438 A1	28-05-1998
		EP 0942901 A1	22-09-1999
		HU 0000437 A2	28-06-2000
		JP 2001506592 T	22-05-2001
		PL 333268 A1	22-11-1999
		TR 9901601 T2	21-09-1999
		US 6274613 B1	14-08-2001
WO 9959967 A	25-11-1999	DE 19822245 A1	25-11-1999
		AU 4036999 A	06-12-1999
		BR 9910540 A	30-01-2001
		WO 9959967 A1	25-11-1999
		EP 1077938 A1	28-02-2001
EP 0183217 A	04-06-1986	AT 53574 T	15-06-1990
		AU 612838 B2	18-07-1991
		AU 3491489 A	07-09-1989
		AU 586653 B2	20-07-1989
		AU 5039685 A	05-06-1986
		CA 1253509 A1	02-05-1989
		CA 1256884 A2	04-07-1989
		CA 1256869 A2	04-07-1989
		DE 3578171 D1	19-07-1990
		EP 0183217 A1	04-06-1986
		IL 88372 A	10-06-1990
		JP 61137858 A	25-06-1986
		US 4778901 A	18-10-1988
		US 4687861 A	18-08-1987
		ZA 8509068 A	30-07-1986

Formblatt PCT/ISA210 (Antrag Patentfamilie), Juli 1992

フロントページの続き

(51)Int.Cl. ⁷	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 31/4439	A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 K 31/454	A 6 1 K 31/454	
A 6 1 K 31/5377	A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 P 33/14	A 6 1 P 33/14	
C 0 7 D 401/12	C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 405/12	C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 409/12	C 0 7 D 409/12	
C 0 7 D 417/12	C 0 7 D 417/12	
// C 0 7 B 61/00	C 0 7 B 61/00	3 0 0

(81)指定国 AP(GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT,BE,CH,CY,DE,DK,ES,FI,FR,GB,GR,IE,IT,LU,MC,NL,PT,SE,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EC,EE,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NO,NZ,PH,PL,PT,RU,SD,SE,SG,SI,SK,SL,TJ,TM,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VN,YU,ZA,ZW

- (72)発明者 アリヒ, ベルント
ドイツ 5 3 6 3 9 ケーニヒスピンター・イムロトジーフエン 7
- (72)発明者 クラーツ, ウド
ドイツ 5 1 3 7 5 レーフエルクーゼン・アンドレアスシュトラッセ 2 2 アー
- (72)発明者 テイールキング, ゲルハルト
ドイツ 5 1 3 9 9 ブルシヤイト・カスタニエンアレー 1 3
- (72)発明者 エルデレン, クリストフ
ドイツ 4 2 7 9 9 ライヒリンゲン・ウンテルビュシヤーホフ 1 5
- (72)発明者 トウルベルク, アンドレアス
ドイツ 4 2 7 8 1 ハーン・ジンターシュトラッセ 8 6
- (72)発明者 ハンゼン, オラフ
ドイツ 4 0 7 6 4 ランゲンフェルト・タネンベーク 4 3

F ターム (参考) 4C063 AA01 BB08 CC12 CC62 CC75 CC92 DD04 EE01 EE03
4C069 AB03 BB08 BB12 BD09
4C086 AA01 AA02 AA03 AA04 BC06 BC08 BC17 BC21 BC73 BC82
GA07 GA09 GA12 MA01 MA04 NA14 ZB37
4H011 AC01 BB09 DA16 DD03
4H039 CA41 CD20