



(19)  
Bundesrepublik Deutschland  
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) DE 601 26 838 T2 2007.11.08

(12)

## Übersetzung der europäischen Patentschrift

(97) EP 1 392 281 B1

(21) Deutsches Aktenzeichen: 601 26 838.5

(86) PCT-Aktenzeichen: PCT/EP01/14926

(96) Europäisches Aktenzeichen: 01 985 421.5

(87) PCT-Veröffentlichungs-Nr.: WO 2002/049641

(86) PCT-Anmeldetag: 18.12.2001

(87) Veröffentlichungstag  
der PCT-Anmeldung: 27.06.2002

(97) Erstveröffentlichung durch das EPA: 03.03.2004

(97) Veröffentlichungstag  
der Patenterteilung beim EPA: 21.02.2007

(47) Veröffentlichungstag im Patentblatt: 08.11.2007

(51) Int Cl.<sup>8</sup>: A61K 31/277 (2006.01)

A61K 31/44 (2006.01)

A61P 33/00 (2006.01)

(30) Unionspriorität:

248900 20.12.2000 CH

(73) Patentinhaber:

Novartis AG, Basel, CH

(74) Vertreter:

PFENNING MEINIG & PARTNER GbR, 80339  
München

(84) Benannte Vertragsstaaten:

AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,  
LI, LU, MC, NL, PT, SE, TR

(72) Erfinder:

DUCRAY, Pierre, F-68128 Village-Neuf, FR;  
BOUVIER, Jacques, CH-2000 Neuchatel, CH

(54) Bezeichnung: Amidoacetonitrile zur Bekämpfung von Endoparasiten

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelebt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99 (1) Europäisches Patentübereinkommen).

Die Übersetzung ist gemäß Artikel II § 3 Abs. 1 IntPatÜG 1991 vom Patentinhaber eingereicht worden. Sie wurde vom Deutschen Patent- und Markenamt inhaltlich nicht geprüft.

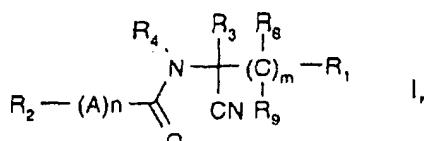
**Beschreibung**

**[0001]** Die vorliegende Erfindung bezieht sich auf die Verwendung von bekannten Aminoacetonitrilverbindungen bei der Bekämpfung von Endoparasiten, speziell Helminthen, bei warmblütigem Nutzvieh und Haustieren.

**[0002]** Es sind Versuche durchgeführt worden, um Helminthen zu bekämpfen, wobei die endoparasitischen Nematoden die Ursache von schweren Krankheiten von Säugern und Geflügel sein können, unter Verwendung einer weniger wichtigen Klasse an Wirkstoffen, beispielsweise Milbemycinen. Jedoch können die Wirkstoffe, die bis heute in der Literatur offenbart sind, nicht immer die Erfordernisse erfüllen, die das Wirksamkeits- und Aktivitätsspektrum betreffen. Es besteht daher die Notwendigkeit nach Wirkstoffen mit verbesserten pestiziden Eigenschaften. Es ist nun herausgefunden worden, daß die hier beschriebenen Aminoacetonitrilverbindungen ausgezeichnete Eigenschaften gegen Endoparasiten aufweisen.

**[0003]** Aminoacetonitrilverbindungen mit pestizider, speziell insektizider, Aktivität für den Schutz von Pflanzen werden beispielsweise in EP 0 953 565 A2 beschrieben. Es ist überraschenderweise gezeigt worden, daß die folgende Auswahl an Verbindungen der Formel I ebenso ausnahmsweise gute Aktivität gegen Endoparasiten von Warmbluttieren aufweist und durch das Wirtstier sehr gut toleriert wird.

**[0004]** Die Verbindungen entsprechen der allgemeinen Formel



worin

$\text{R}_1$  substituiertes  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_4$ -Alkylen bedeutet, wobei die Substituenten aus der Gruppe ausgewählt sind, umfassend unsubstituiertes Aryloxy oder Aryloxy, das durch  $\text{R}_5$  mono- bis penta-substituiert ist, und unsubstituiertes Pyridyloxy oder Pyridyloxy, das durch  $\text{R}_5$  mono- bis tetra-substituiert ist, wobei die Substituenten dieselben oder unterschiedlich sein können, wenn ihre Anzahl größer als 1 ist;

$\text{R}_2$  unsubstituiertes Phenyl oder Phenyl, das durch  $\text{R}_5$  mono- bis penta-substituiert ist, oder unsubstituiertes Pyridyl oder Pyridyl, das durch  $\text{R}_5$  mono- bis tetra-substituiert ist, bedeutet;

$\text{R}_3$  Methyl ist;

$\text{R}_4$  Wasserstoff,  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkyl oder Halogen- $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -alkyl bedeutet;

$\text{R}_5$   $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkyl,  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkoxy, Halogen- $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -alkyl, Halogen- $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -alkoxy,  $\text{C}_2\text{-}\text{C}_6$ -Alkenyl, Halogen- $\text{C}_2\text{-}\text{C}_6$ -alkenyl,  $\text{C}_2\text{-}\text{C}_6$ -Alkinyl, Halogen- $\text{C}_2\text{-}\text{C}_6$ -alkinyl,  $\text{C}_3\text{-}\text{C}_8$ -Cycloalkyl,  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkylcarbonyl, Halogen- $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -alkylcarbonyl,  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkoxy carbonyl, Halogen- $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -alkoxycarbonyl,  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkylsulfonyl,  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkylsulfinyl, Halogen, Cyan oder Nitro bedeutet;  $\text{A}(\text{R}_6)(\text{R}_7)$ ,  $\text{CH}=\text{CH}$  oder  $\text{C}\equiv\text{C}$  bedeutet;

$\text{R}_6$  und  $\text{R}_7$  entweder unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen,  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkyl,  $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -Alkoxy, Halogen- $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -alkyl, Halogen- $\text{C}_1\text{-}\text{C}_6$ -alkoxy oder  $\text{C}_3\text{-}\text{C}_6$ -Cycloalkyl bedeuten; oder zusammen  $\text{C}_2\text{-}\text{C}_6$ -Alkylen bedeuten;

$\text{R}_5$  und  $\text{R}_9$  Wasserstoff sind;

$m$  und  $n$  unabhängig voneinander 0 oder 1 sind;

und gegebenenfalls Enantiomeren davon,

mit der Maßgabe, daß, wenn  $m$  0 ist, dann  $\text{R}_1$  erhalten bleibt.

**[0005]** Alkyl – als eine Gruppe per se und als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen, wie Halogenalkyl, Alkoxy und Alkylthio, – ist in jedem Fall aufgrund der speziellen Anzahl an Kohlenstoffatomen in der in Frage kommenden Gruppe oder Verbindung entweder geradkettig, d. h. Methyl, Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl oder Octyl, oder verzweigt, beispielsweise Isopropyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Isopentyl, Neopentyl oder Isohexyl.

**[0006]** Cycloalkyl – als eine Gruppe per se und als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen, wie Halogencycloalkyl, Cycloalkoxy und Cycloalkylthio, – ist in jedem Fall aufgrund der speziellen Anzahl an Kohlenstoffatomen in der in Frage kommenden Gruppe oder Verbindung Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl oder Cyclooctyl.

**[0007]** Alkenyl – als eine Gruppe per se und als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen – ist in jedem Fall aufgrund der speziellen Anzahl an Kohlenstoffatomen in der in Frage kommenden Gruppe oder Verbindung und der konjugierten oder isolierten Doppelbindungen – entweder geradkettig, beispielsweise

Allyl, 2-Butenyl, 3-Pentenyl, 1-Hexenyl, 1-Heptenyl, 1,3-Hexadienyl oder 1,3-Octadienyl, oder verzweigt, beispielsweise Isopropenyl, Isobut enyl, Isoprepyl, tert-Pentenyl, Isohexenyl, Isoheptenyl oder Isooctenyl.

**[0008]** Alkinyl – als eine Gruppe per se und als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen – ist in jedem Fall aufgrund der spezielle Anzahl an Kohlenstoffatomen in der in Frage kommenden Gruppe oder Verbindung und den konjugierten oder isolierten Doppelbindungen – entweder geradkettig, beispielsweise Propargyl, 2-Butinyl, 3-Pentinyl, 1-Hexinyl, 1-Heptinyl, 3-Hexen-1-inyl oder 1,5-Heptadien-3-inyl, oder verzweigt, beispielsweise 3-Methylbut-1-inyl, 4-Ethylpent-1-inyl, 4-Methylhex-2-inyl oder 2-Methylhept-3-inyl.

**[0009]** Aryloxy ist Phenoxy oder 1- oder 2-Naphthyloxy.

**[0010]** In der Regel bedeutet Halogen Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Dasselbe trifft auf Halogen in Kombination mit anderen Bedeutungen zu, wie Halogenalkyl oder Halogenphenyl.

**[0011]** Halogen-substituierte Kohlenstoff-enthaltende Gruppen und Verbindungen können teilweise halogeniert oder perhalogeniert sein, wobei im Fall von mehrfacher Halogenierung die Halogensubstituenten identisch oder unterschiedlich sein können. Beispiele von Halogenalkyl – als eine Gruppe per se und als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen, wie Halogen-alkoxy oder Halogen-alkylthio, – sind Methyl, das durch Fluor, Chlor und/oder Brom mono- bis trisubstituiert ist, wie  $\text{CHF}_2$  oder  $\text{CF}_3$ ; Ethyl, das durch Fluor, Chlor und/oder Brom mono- bis pentasubstituiert ist, wie  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{CF}_2\text{CCl}_3$ ,  $\text{CF}_2\text{CHCl}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CHF}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CCl}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CHBr}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CHClF}$ ,  $\text{CF}_2\text{CHBrF}$  oder  $\text{CClFCHClF}$ ; Propyl oder Isopropyl, das durch Fluor, Chlor und/oder Brom mono- bis heptasubstituiert ist, wie  $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ ,  $\text{CF}_2\text{CHFCF}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$  oder  $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ ; Butyl oder eines seiner Isomere, das durch Fluor, Chlor und/oder Brom mono- bis nonasubstituiert ist, wie  $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCF}_3$  oder  $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ ; Pentyl oder eines seiner Isomere, das durch Fluor, Chlor und/oder Brom ein- bis elfmal substituiert ist, wie  $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$  oder  $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ ; und Hexyl oder eines seiner Isomere, das durch Fluor, Chlor und/oder Brom ein- bis dreizehnmal substituiert ist, wie  $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ ,  $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$ ,  $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$  oder  $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ .

**[0012]** Alkoxygruppen weisen bevorzugt eine Kettenlänge von 1 bis 6 Kohlenstoffatomen auf. Alkoxy ist beispielsweise Methoxy, Ethoxy, Propoxy, Isopropoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy und tert-Butoxy, sowie die Isomere Pentyloxy und Hexyloxy; bevorzugt Methoxy und Ethoxy. Halogenalkoxygruppen weisen bevorzugt eine Kettenlänge von 1 bis 6 Kohlenstoffatomen auf. Halogenalkoxy ist beispielsweise Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2,2-Difluorethoxy und 2,2,2-Trichlorethoxy; bevorzugt Difluormethoxy, 2-Chlorethoxy und Trifluormethoxy.

**[0013]** Bevorzugte Ausführungsformen innerhalb des Umfangs der Erfindung sind:

- (1) Eine Verbindung der Formel I, worin  $R_1$  substituiertes  $C_1\text{-}C_4$ -Alkylen ist, wobei die Substituenten aus der Gruppe ausgewählt sind, umfassend unsubstituiertes Phenoxy oder Phenoxy, das durch  $R_5$  mono- bis tri-substituiert ist, wobei die Substituenten identisch oder unterschiedlich sein können, wenn ihre Anzahl größer als 1 ist; insbesondere substituiertes  $C_1\text{-}C_2$ -Alkylen, wobei die Substituenten aus der Gruppe ausgewählt sind, umfassend unsubstituiertes Phenoxy oder Phenoxy, das durch  $R_5$  mono- bis tri-substituiert ist, wobei die Substituenten identisch oder unterschiedlich sein können, wenn ihre Anzahl größer als 1 ist; am stärksten bevorzugt substituiertes Methylen, wobei die Substituenten aus der Gruppe ausgewählt sind, umfassend unsubstituiertes Phenoxy oder Phenoxy, das durch  $R_5$  mono- bis di-substituiert ist, wobei die Substituenten identisch oder unterschiedlich sein können, wenn ihre Anzahl größer als 1 ist;
- (2) eine Verbindung der Formel I, worin  $R_2$  unsubstituiertes Phenyl oder Phenyl, das durch  $R_5$  mono- bis penta-substituiert ist, insbesondere Phenyl, das durch  $R_5$  mono- bis tri-substituiert ist; am stärksten bevorzugt Phenyl, das durch  $R_5$  mono- bis di-substituiert ist, ist;
- (3) eine Verbindung der Formel I, worin  $R_4$  Wasserstoff oder  $C_1\text{-}C_6$ -Alkyl; insbesondere Wasserstoff oder  $C_1\text{-}C_2$ -Alkyl; am stärksten bevorzugt Wasserstoff, ist;
- (4) eine Verbindung der Formel I, worin  $R_5$   $C_1\text{-}C_6$ -Alkyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkoxy, Halogen- $C_1\text{-}C_6$ -alkyl, Halogen- $C_1\text{-}C_6$ -alkoxy,  $C_2\text{-}C_6$ -Alkenyl, Halogen- $C_2\text{-}C_6$ -alkenyl,  $C_2\text{-}C_6$ -Alkinyl, Halogen- $C_2\text{-}C_6$ -alkinyl,  $C_3\text{-}C_8$ -Cycloalkyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkylcarbonyl, Halogen- $C_1\text{-}C_6$ -alkylcarbonyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkoxycarbonyl, Halogen- $C_1\text{-}C_6$ -alkoxy-carbonyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkylsulfinyl, Halogen, Cyano oder Nitro; speziell  $C_1\text{-}C_4$ -Alkyl,  $C_1\text{-}C_4$ -Alkoxy, Halogen- $C_1\text{-}C_4$ -alkyl, Halogen- $C_1\text{-}C_4$ -alkoxy, Halogen, Cyano oder Nitro; am stärksten bevorzugt  $C_1\text{-}C_2$ -Alkyl, Halogen- $C_1\text{-}C_2$ -alkyl, Halogen, Cyano oder Nitro; speziell Halogen- $C_1\text{-}C_2$ -alkyl oder Halogen, ist;
- (5) eine Verbindung der Formel I, worin A  $C(R_6)(R_7)$  oder  $\text{CH}=\text{CH}$ ; speziell  $C(R_6)(R_7)$ , ist;
- (6) eine Verbindung der Formel I, worin  $R_6$  und  $R_7$  entweder unabhängig voneinander Wasserstoff;  $C_1\text{-}C_4$ -Alkyl oder  $C_3\text{-}C_6$ -Cycloalkyl sind; oder zusammen  $C_2\text{-}C_6$ -Alkylen; speziell unabhängig voneinander Wasser-

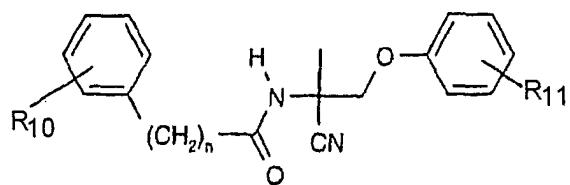
stoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkyl; am stärksten bevorzugt Wasserstoff, sind;  
(7) eine Verbindung der Formel I, worin m 0 ist;  
(8) eine Verbindung der Formel I, worin n 1 ist;  
(9) eine Verbindung der Formel I, worin R<sub>1</sub> substituiertes Methylen ist, wobei die Substituenten aus der Gruppe ausgewählt sind, umfassend unsubstituiertes Phenoxy oder Phenoxy, das durch R<sub>5</sub> mono- bis di-substituiert ist, wobei die Substituenten identisch oder unterschiedlich sein können, wenn ihre Anzahl größer als 1 ist; R<sub>2</sub> Phenyl ist, das durch R<sub>5</sub> mono- bis di-substituiert ist; R<sub>3</sub> Methyl ist, R<sub>4</sub> Wasserstoff ist, R<sub>5</sub> Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl oder Halogen ist; A C(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>) ist; R<sub>6</sub> und R<sub>7</sub> Wasserstoff sind, m 0 ist und n 1 ist.

**[0014]** Die Verbindungen der Formel I, die in der folgenden Tabelle genannt sind, sind besonders bevorzugt.

**[0015]** Die Verbindungen I können in Form von einem der möglichen Isomere oder als ein Gemisch davon beispielsweise in Abhängigkeit der Anzahl, absoluten und relativen Konfigurationen der asymmetrischen Kohlenstoffatome als reine Isomere, wie Antipoden und/oder Diastereoisomere, oder als isomere Gemische, wie enantiomere Gemische, beispielsweise Racemate, diastereoisomere Gemische oder racemische Gemische vorliegen; die Erfindung bezieht sich sowohl auf die reinen Isomere sowie alle der möglichen isomeren Gemische, und ist wie hierin zuvor und hierin nachstehend als solches zu verstehen, selbst wenn stereochemische Einzelheiten nicht in jedem Fall speziell genannt werden.

**[0016]** Die Synthese der Verbindungen wird beispielsweise in EP 0 953 565 A2 beschrieben.

Tabelle 1



Nr.	n	R <sub>10</sub>	R <sub>11</sub>	phys. Daten
1.1	0	2-Cl	2-Cl	
1.2	0	2-Cl	3-Cl	
1.3	0	2-Cl	4-Cl	Smp. 137-9°
1.4	0	2-Cl	2,3-Cl <sub>2</sub>	
1.5	0	2-Cl	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1.6	0	2-Cl	2,5-Cl <sub>2</sub>	
1.7	0	2-Cl	2,6-Cl <sub>2</sub>	Smp. 178-80°
1.8	0	2-Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>	
1.9	0	2-Cl	3,5-Cl <sub>2</sub>	
1.10	0	2-Cl	2-CF <sub>3</sub>	Smp. 47-49°
1.11	0	2-Cl	3-CF <sub>3</sub>	
1.12	0	2-Cl	4-CF <sub>3</sub>	Smp. 131-3°
1.13	0	3-Cl	2-Cl	
1.14	0	3-Cl	3-Cl	
1.15	0	3-Cl	4-Cl	
1.16	0	3-Cl	2,3-Cl <sub>2</sub>	
1.17	0	3-Cl	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1.18	0	3-Cl	2,5-Cl <sub>2</sub>	
1.19	0	3-Cl	2,6-Cl <sub>2</sub>	
1.20	0	3-Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>	
1.21	0	3-Cl	3,5-Cl <sub>2</sub>	
1.22	0	3-Cl	2-CF <sub>3</sub>	
1.23	0	3-Cl	3-CF <sub>3</sub>	
1.24	0	3-Cl	4-CF <sub>3</sub>	
1.25	0	4-Cl	2-Cl	
1.26	0	4-Cl	3-Cl	

1.27	0	4-Cl	4-Cl
1.28	0	4-Cl	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.29	0	4-Cl	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.30	0	4-Cl	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.31	0	4-Cl	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.32	0	4-Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.33	0	4-Cl	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.34	0	4-Cl	2-CF <sub>3</sub>
1.35	0	4-Cl	3-CF <sub>3</sub>
1.36	0	4-Cl	4-CF <sub>3</sub>
1.37	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.38	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	3-Cl
1.39	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	4-Cl Smp. 190-2°
1.40	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.41	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.42	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.43	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.44	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.45	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.46	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.47	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.48	0	2,3-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub> Smp. 155-7°
1.49	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.50	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	3-Cl Smp. 122-3°
1.51	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl Smp. 143-5°
1.52	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.53	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.54	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.55	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.56	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.57	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.58	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.59	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>

1.60	0	2,4-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	Smp. 99-102°
1.61	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	2-Cl	
1.62	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	3-Cl	
1.63	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	
1.64	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>	
1.65	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1.66	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>	
1.67	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	
1.68	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	
1.69	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	
1.70	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
1.71	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	
1.72	0	2,5-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
1.73	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	2-Cl	
1.74	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	3-Cl	
1.75	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	
1.76	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>	
1.77	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1.78	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>	
1.79	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	
1.80	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	
1.81	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	
1.82	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
1.83	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	
1.84	0	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
1.85	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-Cl	
1.86	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	3-Cl	
1.87	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	
1.88	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>	
1.89	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1.90	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>	
1.91	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	
1.92	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	

1.93	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.94	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.95	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.96	0	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub> Smp.93-5°
1.97	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.98	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	3-Cl
1.99	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	4-Cl
1.100	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.101	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.102	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.103	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.104	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.105	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.106	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.107	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.108	0	3,5-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.109	0	2-CF <sub>3</sub>	2-Cl
1.110	0	2-CF <sub>3</sub>	3-Cl
1.111	0	2-CF <sub>3</sub>	4-Cl
1.112	0	2-CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.113	0	2-CF <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.114	0	2-CF <sub>3</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.115	0	2-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> Smp.168-70°
1.116	0	2-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.117	0	2-CF <sub>3</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.118	0	2-CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.119	0	2-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.120	0	2-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Smp.148.5°
1.121	0	3-CF <sub>3</sub>	2-Cl
1.122	0	3-CF <sub>3</sub>	3-Cl
1.123	0	3-CF <sub>3</sub>	4-Cl
1.124	0	3-CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.125	0	3-CF <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>

1.126	0	3-CF <sub>3</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.127	0	3-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.128	0	3-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.129	0	3-CF <sub>3</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.130	0	3-CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.131	0	3-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.132	0	3-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.133	0	4-CF <sub>3</sub>	2-Cl
1.134	0	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl Smp.160-2°
1.135	0	4-CF <sub>3</sub>	4-Cl Smp.147-9°
1.136	0	4-CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.137	0	4-CF <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.138	0	4-CF <sub>3</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.139	0	4-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.140	0	4-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.141	0	4-CF <sub>3</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.142	0	4-CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.143	0	4-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.144	0	4-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Smp.140-3°
1.145	1	2-Cl	2-Cl
1.146	1	2-Cl	3-Cl
1.147	1	2-Cl	4-Cl
1.148	1	2-Cl	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.149	1	2-Cl	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.150	1	2-Cl	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.151	1	2-Cl	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.152	1	2-Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.153	1	2-Cl	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.154	1	2-Cl	2-CF <sub>3</sub>
1.155	1	2-Cl	3-CF <sub>3</sub>
1.156	1	2-Cl	4-CF <sub>3</sub>
1.157	1	3-Cl	2-Cl
1.158	1	3-Cl	3-Cl

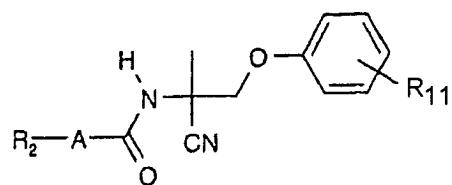
1.159	1	3-Cl	4-Cl
1.160	1	3-Cl	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.161	1	3-Cl	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.162	1	3-Cl	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.163	1	3-Cl	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.164	1	3-Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.165	1	3-Cl	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.166	1	3-Cl	2-CF <sub>3</sub>
1.167	1	3-Cl	3-CF <sub>3</sub>
1.168	1	3-Cl	4-CF <sub>3</sub>
1.169	1	4-Cl	2-Cl
1.170	1	4-Cl	3-Cl
1.171	1	4-Cl	4-Cl
1.172	1	4-Cl	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.173	1	4-Cl	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.174	1	4-Cl	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.175	1	4-Cl	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.176	1	4-Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.177	1	4-Cl	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.178	1	4-Cl	2-CF <sub>3</sub>
1.179	1	4-Cl	3-CF <sub>3</sub>
1.180	1	4-Cl	4-CF <sub>3</sub>
1.181	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.182	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	3-Cl
1.183	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	4-Cl
1.184	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.185	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.186	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.187	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.188	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.189	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.190	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.191	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>

1.192	1	2,3-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.193	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.194	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	3-Cl Smp. 151-3°
1.195	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl Smp. 102-4°
1.196	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.197	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.198	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.199	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.200	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.201	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.202	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.203	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.204	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub> Smp. 94-6°
1.205	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.206	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	3-Cl
1.207	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	4-Cl
1.208	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.209	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.210	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.211	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.212	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.213	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.214	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.215	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.216	1	2,5-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.217	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.218	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	3-Cl
1.219	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-Cl
1.220	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.221	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.222	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.223	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.224	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>

1.225	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.226	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.227	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.228	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.229	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.230	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	3-Cl
1.231	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl
1.232	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.233	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.234	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.235	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.236	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.237	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.238	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.239	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.240	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.241	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	2-Cl
1.242	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	3-Cl
1.243	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	4-Cl
1.244	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.245	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.246	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.247	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.248	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.249	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.250	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.251	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.252	1	3,5-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.253	1	2-CF <sub>3</sub>	2-Cl
1.254	1	2-CF <sub>3</sub>	3-Cl
1.255	1	2-CF <sub>3</sub>	4-Cl
1.256	1	2-CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.257	1	2-CF <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>

1.258	1	2-CF <sub>3</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.259	1	2-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.260	1	2-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.261	1	2-CF <sub>3</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.262	1	2-CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.263	1	2-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.264	1	2-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.265	1	3-CF <sub>3</sub>	2-Cl
1.266	1	3-CF <sub>3</sub>	3-Cl
1.267	1	3-CF <sub>3</sub>	4-Cl
1.268	1	3-CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.269	1	3-CF <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.270	1	3-CF <sub>3</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.271	1	3-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.272	1	3-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.273	1	3-CF <sub>3</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.274	1	3-CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.275	1	3-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.276	1	3-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>
1.277	1	4-CF <sub>3</sub>	2-Cl
1.278	1	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl Smp. 136-8°
1.279	1	4-CF <sub>3</sub>	4-Cl Smp. 133-5°
1.280	1	4-CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>
1.281	1	4-CF <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>
1.282	1	4-CF <sub>3</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>
1.283	1	4-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1.284	1	4-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>
1.285	1	4-CF <sub>3</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>
1.286	1	4-CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>
1.287	1	4-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>
1.288	1	4-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Smp. 126-8°

Tabelle 2



Nr.	A	R <sub>11</sub>	R <sub>2</sub>	phys. Daten
2.1	-	H	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 137°
2.2	-	2-F	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 155°
2.3	-	2-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -2-F	
2.4	-	2-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-F	
2.5	-	2-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CH <sub>3</sub>	
2.6	-	2-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-C(O)CH <sub>3</sub>	Smp. 135-7°
2.7	-	2-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2,6-F <sub>2</sub>	Smp. 108-11°
2.8	-	2-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-F-4-CF <sub>3</sub>	
2.9	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2,6-F <sub>2</sub>	Smp. 40-4°
2.10	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CH <sub>3</sub>	Smp. 147-50°
2.11	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Smp. 160-3°
2.12	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-OCH <sub>3</sub>	Smp. 180-2°
2.13	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Smp. 45-9°
2.14	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-SCF <sub>3</sub>	Smp. 78-82°
2.15	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-C(O)OCH <sub>3</sub>	Smp. 144-6°
2.16	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-C(O)CF <sub>3</sub>	Smp. 52-6°
2.17	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Smp. 137-40°
2.18	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Smp. 49-52°
2.19	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-F-4-CF <sub>3</sub>	
2.20	-	2-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -3-F-4-CF <sub>3</sub>	Smp. 149-50°
2.21	-	2-CF <sub>3</sub>	3-C <sub>5</sub> H <sub>3</sub> N-6-Cl	Smp. 138-40°
2.22	-	2-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 86°
2.23	-	2-OCF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 105°
2.24	-	4-S(O <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	
2.25	-	2-C(O)OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 118°
2.26	-	2,4-F <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 130°

2.27	-	2,5-F <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 125°
2.28	-	2,5-Cl <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 140°
2.29	-	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 133°
2.30	-	2-Cl, 5-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-C(O)CF <sub>3</sub>	Smp. 46-50°
2.31	-	2-Cl, 5-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 141°
2.32	-	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 146°
2.33	-	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 122°
2.34	-	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 71°
2.35	-	2-F, 5-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 133°
2.36	-	2-F, 5-CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 127°
2.37	-	2,3,6-F <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub>	Smp. 150-1°

---

**[0017]** Die Verbindungen I gemäß der Erfindung besitzen ein bemerkenswert breites Aktivitätsspektrum und sind wertvolle Wirkstoffe im Bereich der Schädlingsbedämpfung, einschließlich insbesondere der Bekämpfung von Endoparasiten, speziell Helminthen, bei Tieren, während sie von Warmblüttieren, Fischen und Pflanzen gut toleriert werden. Diese umfassen endoparasitische Nematoden, die die Ursache für schwere Krankheiten von Säugern und Geflügel sein können, beispielsweise Schafe, Schweine, Ziegen, Vieh, Pferde, Esel, Hunde, Katzen, Meerschweinchen und exotische Vögel. Typische Nematoden von dieser Indikation sind: Haemonchus, Trichostrongylus, Ostertagia, Nematodirus, Cooperia, Ascaris, Bunostomum, Oesophagostomum, Charbertia, Trichuris, Strongylus, Trichonema, Dictyocaulus, Capillaria, Heterakis, Toxocara, Ascaridia, Oxyuris, Ancylostoma, Uncinaria, Toxascaris und Parascaris. Der besondere Vorteil der Verbindungen der Formel I ist ihre Wirksamkeit gegen diese Parasiten, die gegen Wirkstoffe, die auf Benzimidazol basieren, resistent sind.

**[0018]** Bestimmte Schädlinge der Spezies Nematodirus, Cooperia und Oesophagostomum befallen den Darmtrakt des Wirtstieres, während andere der Spezies Haemonchus und Ostertagia im Magen parasitisch sind und die der Spezies Dictyocaulus in dem Lungengewebe parasitisch sind. Parasiten der Familien Filariidae und Setariidae können in dem Innenzellgewebe und in den Organen gefunden werden, beispielsweise dem Herz, den Blutgefäßen, den Lymphgefäßen und dem subkutanen Bindegewebe. Ein besonders bemerkenswerter Parasit ist der Herzwurm des Hundes, Dirofilaria immitis. Die Verbindungen der Formel I sind gegen diese Parasiten sehr wirksam.

**[0019]** Außerdem sind die Verbindungen der Formel I zur Bekämpfung von menschlichen pathogenen Parasiten geeignet. Von diesen sind typische Vertreter, die in dem Verdauungstrakt auftreten, die der Spezies Ancylostoma, Necator, Ascaris, Strongyloides, Trichinella, Capillaria, Trichuris und Enterobius. Die Verbindungen der vorliegenden Erfindung sind ebenso gegen Parasiten der Spezies Wuchereria, Brugia, Onchocerca und Loa von der Familie der Filariidae, die im Blut, im Gewebe und in verschiedenen Organen auftreten, und ebenso gegen Dracunculus und Parasiten der Spezies Strongyloides und Trichinella, die speziell den Magen-Darm-Trakt befallen, wirksam.

**[0020]** Die gute pestizide Aktivität der Verbindungen der Formel I entspricht einer Sterblichkeitsrate von mindestens 50 bis 60 % der genannten Schädlinge. Insbesondere sind die Verbindungen der Formel I hinsichtlich der ausnahmsweise langen Wirkungsdauer bemerkenswert.

**[0021]** Die Verbindungen der Formel I werden bevorzugt in nicht-modifizierter Form oder bevorzugt zusammen mit den Hilfsmitteln, die konventionell in der Formulierungstechnik verwendet werden, eingesetzt und können deshalb in einer bekannten Weisen verarbeitet werden, um beispielsweise emulgierbare Konzentrate, direkt verdünnbare Lösungen, verdünnte Emulsionen, lösliche Pulver, Granulate oder Mikroinkapselungen in polymeren Substanzen zu erhalten. Was die Zusammensetzungen betrifft, werden die Verabreichungsverfahren gemäß der beabsichtigten Ziele und der vorherrschenden Umstände ausgewählt.

**[0022]** Die Formulierung, d. h. die Mittel, Präparate oder Zusammensetzungen, die den Wirkstoff der Formel I oder Kombinationen dieser Wirkstoffe mit anderen Wirkstoffen, und gegebenenfalls ein festes oder flüssiges Hilfsmittel enthalten, werden in einer an sich bekannten Weise hergestellt, beispielsweise durch gründliches Mischen und/oder Mahlen der Wirkstoffe mit Verteilungszusammensetzungen, beispielsweise mit Lösungsmitt-

teln, festen Trägern und gegebenenfalls oberflächenaktiven Verbindungen (oberflächenaktiven Mitteln).

**[0023]** Die in Frage kommenden Lösungsmittel können sein: Alkohole, wie Ethanol, Propanol oder Butanol, und Glykole und ihre Ether und Ester, wie Propylenglykol, Dipropylenglykolether, Ethylenglykol, Ethylen glykol-monomethyl- oder -ethylether, Ketone, wie Cyclohexanon, Isophoron oder Diacetanolalkohol, stark polare Lösungsmittel, wie N-Methyl-2-pyrrolidon, Dimethylsulfoxid oder Dimethylformamid, oder Wasser, Pflanzenöle, wie Raps-, Rizinus-, Kokosnuss- oder Sojabohnenöl, und gegebenenfalls auch Silikonöle.

**[0024]** Bevorzugte Verabreichungsformen zur Verwendung bei Warmbluttieren bei der Bekämpfung von Helminthen umfassen Lösungen, Emulsionen, Suspensionen (Beizen), Nahrungsmittelzusätze, Pulver, Tabletten, einschließlich Brausetabletten, große Pillen, Kapseln, Mikrokapseln und Aufgießformulierungen, wobei die physiologische Kompatibilität der Formulierungsträgerstoffe berücksichtigt werden müssen.

**[0025]** Die Bindemittel für Tabletten und große Pillen können chemisch modifizierte, polymere, natürliche Substanzen sein, die in Wasser oder in Alkohol löslich sind, wie Stärke, Cellulose oder Proteinderivate (beispielsweise Methylcellulose, Carboxymethylcellulose, Ethylhydroxyethylcellulose, Proteine, wie Zein, Gelatine und dergleichen), sowie synthetische Polymere, wie Polyvinylalkohol, Polyvinylpyrrolidon usw. Die Tabletten enthalten ebenso Füllstoffe (beispielsweise Stärke, mikrokristalline Cellulose, Zucker, Laktose usw.), Gleitmittel und Lösungsvermittler.

**[0026]** Wenn die Anthelminthika in Form von Futterkonzentraten vorliegen, dann sind die verwendeten Träger beispielsweise Kraftfutter, Futterkörner oder Proteinkonzentrate. Diese Futterkonzentrate oder -zusammensetzungen können neben den Wirkstoffen ebenso Additive, Vitamine, Antibiotika, Chemotherapeutika oder andere Pestizide, in erster Linie Bakteriostatika, Fungistatika, Kokzidiostatika oder sogar Hormonpräparate, Substanzen, die anabolische Wirkung aufweisen, oder Substanzen, die das Wachstum beschleunigen, enthalten, welche die Qualität des Tierfleisches für den Schlachter beeinflussen, oder welche für den Organismus in einer anderen Weise von Nutzen sind. Wenn die Zusammensetzungen oder die darin enthaltenden Wirkstoffe der Formel I direkt zu dem Futter oder zu den Selbsttränkebecken zugegeben werden, dann enthält das formulierte Futter oder Trinkwasser die Wirkstoffe beispielsweise in einer Konzentration von 0,0005 bis 0,02 Gew.-% (5 bis 200 ppm).

**[0027]** Die Verbindungen der Formel I gemäß der Erfindung können allein oder in Kombination mit anderen Bioziden verwendet werden. Sie können mit Pestiziden mit denselben Wirkungskreisen kombiniert werden, um beispielsweise die Aktivität zu erhöhen, oder mit Substanzen mit einem anderen Wirkungskreis, um beispielsweise den Aktivitätsbereich zu erweitern. Es kann ebenso sinnvoll sein, sogenannte Abwehrmittel zuzugeben. Wenn der Aktivitätsbereich auf Endoparasiten, beispielsweise Würmer, erweitert werden soll, werden die Verbindungen der Formel I geeigneterweise mit Substanzen mit endoparasitischen Eigenschaften kombiniert. Natürlich können sie ebenso in Kombination mit antibakteriellen Zusammensetzungen verwendet werden. Da die Verbindungen der Formel I Adultizide sind, d. h. da sie insbesondere gegen das Erwachsenenstadium der Zielparasiten wirksam sind, kann die Zugabe von Pestiziden, die statt dessen das Jugendstadium der Parasiten befallen, sehr vorteilhaft sein. In dieser Weise wird der größte Teil dieser Parasiten, die großen wirtschaftlichen Schaden anrichten, abgedeckt werden. Außerdem wird diese Wirkung wesentlich zur Vermeidung der Bildung von Resistenz beitragen. Viele Kombinationen können ebenso zu synergistischen Wirkungen führen, d. h. die Gesamtmenge an Wirkstoff kann verringert werden, was aus ökologischer Sicht wünschenswert ist. Bevorzugte Gruppen von Kombinationspartnern und besonders bevorzugte Kombinationspartner werden im folgenden genannt, wobei die Kombinationen einen oder mehrere dieser Partner zusätzlich zu einer Verbindung der Formel I enthalten können.

**[0028]** Geeignete Partner in dem Gemisch können Biozide, beispielsweise die Insektizide und Akarizide mit variierendem Aktivitätsmechanismus, sein, die im folgenden genannt werden und seit längerem dem Fachmann bekannt waren, beispielsweise Chitinsyntheseinhibitoren, Wachstumsregulatoren; Wirkstoffe, die als Juvenilhormone fungieren; Wirkstoffe, die als Adultizide fungieren; Breitband-Insektizide, Breitband-Akarizide und Nematozide; und ebenso die allgemein bekannten Anthelminthika und Insekten- und/oder Akarizidenabschreckenden Substanzen, die Abwehrmittel oder Entfernungsmittel.

**[0029]** Beispiele von geeigneten Insektiziden und Akariziden sind:

1. Abamectin	18. Benfuracarb	35. Chlorethoxyfos
2. AC 303 630	19. Bensultap	36. Chlorfenapyr
3. Acephat	20. $\beta$ -Cyfluthrin	37. Chlorfluazuron
4. Acrinathrin	21. Bifenthrin	38. Chlormephos
5. Alanycarb	22. BPMC	39. Chlorpyrifos
6. Aldicarb	23. Brofenprox	40. Cis-Resmethrin
7. $\alpha$ -Cypermethrin	24. Bromophos A	41. Clocythrin
8. Alphamethrin	25. Bufencarb	42. Clofentezin
9. Amitraz	26. Buprofezin	43. Cyanophos
10. Avermectin B <sub>1</sub>	27. Butocarboxin	44. Cycloprothrin
11. AZ 60541	28. Butylpyridaben	45. Cyfluthrin
12. Azinphos A	29. Cadusafos	46. Cyhexatin
13. Azinphos M	30. Carbaryl	47. D 2341
14. Azinphos-methyl	31. Carbofuran	48. Deltamethrin
15. Azocyclotin	32. Carbophenthion	49. Demeton M
16. <i>Bacillus subtil.</i> toxin	33. Cartap	50. Demeton S
17. Bendiocarb	34. Chloethocarb	51. Demeton-S-methyl

52. Dibutylaminothio	84. Fluazuron	114. Methiocarb
53. Dichlofenthion	85. Flucycloxuron	115. Methomyl
54. Dicliphos	86. Flucythrinate	116. Methoprene
55. Diethion	87. Flufenoxuron	117. Metolcarb
56. Diflubenzuron	88. Flufenprox	118. Mevinphos
57. Dimethoat	89. Fonophos	119. Milbemectin
58. Dimethylvinphos	90. Formothion	120. Moxidectin
59. Dioxathion	91. Fosthiazat	121. Naled
60. DPX-MP062	92. Fubfenprox	122. NC 184
61. Edifenphos	93. HCH	123. NI-25, Acetamiprid
62. Emamectin	94. Heptenophos	124. Nitencyram
63. Endosulfan	95. Hexaflumuron	125. Omethoat
64. Esfenvalerate	96. Hexythiazox	126. Oxamyl
65. Ethiofencarb	97. Hydroprene	127. Oxydemethon M
66. Ethion	98. Imidacloprid	128. Oxydeprofos
67. Ethofenprox	99. Insekten-aktive Pilze	129. Parathion
68. Ethoprophos	100. Insekten-aktive Nematoden	130. Parathion-methyl
69. Etriphos	101. Insekten-aktive Viren	131. Permethrin
70. Fenamiphos	102. Iprobenfos	132. Phenthroate
71. Fenazaquin	103. Isofenphos	133. Phorat
72. Fenbutatinoxid	104. Isoprocarb	134. Phosalone
73. Fenitrothion	105. Isoxathion	135. Phosmet
74. Fenobucarb	106. Ivermectin	136. Phoxim
75. Fenothiocarb	107. λ-Cyhalothrin	137. Pirimicarb
76. Fenoxycarb	108. Lufenuron	138. Pirimiphos A
77. Fenpropothrin	109. Malathion	139. Pirimiphos M
78. Fenpyrad	110. Mecarbam	140. Promecarb
79. Fenpyroximate	111. Mesulfenphos	141. Propaphos
80. Fenthion	112. Metaldehyd	142. Propoxur
81. Fenvalerate	113. Methamidophos	143. Prothiofos
82. Fipronil		144. Prothoat
83. Fluazinam		145. Pyrachlophos

146.Pyradaphenthion	161.Tebufenpyrad	176.Triazamate
147.Pyresmethrin	162.Tebupirimphos	177.Triazophos
148.Pyrethrum	163.Teflubenzuron	178.Triazuron
149.Pyridaben	164.Tefluthrin	179.Trichlorfon
150.Pyrimidifen	165.Temephos	180.Triflumuron
151.Pyriproxyfen	166.Terbam	181.Trimethacarb
152.RH 5992	167.Terbufos	182.Vamidothion
153.RH-2485	168.Tetrachlorvinphos	183.XMC (3,5,-Xylmethylcarbamat)
154.Salithion	169.Thiafenox	184.Xylylcarb
155.Sebufos	170.Thiodicarb	185.YI 5301/5302
156.Silafluofen	171.Thiofanox	186.ζ-Cypermethrin
157.Spinosad	172.Thionazin	187.Zetamethrin
158.Sulfotep	173.Thuringiensin	
159.Sulprofos	174.Tralomethrin	
160.Tebufenozide	175.Triarthen	

[0030] Beispiele von geeigneten Anthelminthika werden im folgenden genannt, einige Vertreter haben insektizide und akarizide Aktivität zusätzlich zu der anthelminthischen Aktivität, und sind teilweise bereits in der obigen Liste.

- (A1) Praziquantel = 2-Cyclohexylcarbonyl-4-oxo-1,2,3,6,7,11b-hexahydro-4H-pyrazino[2,1- $\alpha$ ]isochinolin
- (A2) Closantel = 3,5-Diiod-N-[5-chlor-2-methyl-4( $\alpha$ -cyano-4-chlorbenzyl)phenyl]salicylamid
- (A3) Triclabendazole = 5-Chlor-6-(2,3-dichlorphenoxy)-2-methylthio-1H-benzimidazol
- (A4) Levamisol = L-( $-$ )-2,3,5,6-Tetrahydro-6-phenylimidazo[2,1b]thiazol
- (A5) Mebendazole = (5-Benzoyl-1H-benzimidazol-2-yl)carbaminsäuremethylester
- (A6) Omphalotin = ein makrocyclisches Fermentationsprodukt des Fungus Omphalotus olearius, beschrieben in WO 97/20857
- (A7) Abamectin = Avermectin B1
- (A8) Ivermectin = 22,23-Dihydroavermectin B1
- (A9) Moxidectin = 5-O-Demethyl-28-deoxy-25-(1,3-dimethyl-1-but enyl)-6,28-epoxy-23-(methoxyimino)-milbemycin B
- (A10) Doramectin = 25-Cyclohexyl-5-O-demethyl-25-de(1-methylpropyl)-avermectin A1a
- (A11) Milbemectin = Gemisch aus Milbemycin A3 und Milbemycin A4
- (A12) Milbemycinoxim = 5-Oxim von Milbemectin

[0031] Nicht-einschränkende Beispiele von geeigneten Abwehrmitteln und Entfernungsmitteln sind:

- (R1) DEET (N,N-Diethyl-m-toluamid)
- (R2) KBR 3023 N-Butyl-2-oxycarbonyl-(2-hydroxy)-piperidin
- (R3) Cymiazol = N-2,3-Dihydro-3-methyl-1,3-thiazol-2-yliden-2,4-xyldien

[0032] Die Partner in dem Gemisch sind den Spezialisten auf diesem Gebiet wohl bekannt. Die meisten werden in verschiedenen Auflagen des Pesticide Manual, The British Crop Protection Council, London, und anderen in den verschiedenen Auflagen von The Merck Index, Merck & Co., Inc., Rahway, New Jersey, USA oder in der Patentliteratur beschrieben. Deshalb ist die folgende Auflistung auf einige Stellen beschränkt, wo sie mittels der Beispiele gefunden werden können.

- (I) 2-Methyl-2-(methylthio)propionaldehyd-O-methylcarbamoyloxim (Aldicarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 26;
- (II) S-(3,4-Dihydro-4-oxobenzo[d]-[1,2,3]-triazin-3-ylmethyl)O,O-dimethylphosphordithioat (Azinphos-methyl), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 67;
- (III) Ethyl-N-[2,3-dihydro-2,2-dimethylbenzofuran-7-yloxycarbonyl(methyl)aminothio]-N-isopropyl-β-alaninat

- (Benfuracarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 96;
- (IV) 2-Methylbiphenyl-3-ylmethyl-(Z)-(1RS)-cis-3-(2-chlor-3,3,3-trifluorprop-1-enyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat (Bifenthrin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 118;
- (V) 2-tert-Butylimino-3-isopropyl-5-phenyl-1,3,5-thiadiazian-4-on (Buprofezin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 157;
- (VI) 2,3-Dihydro-2,2-dimethylbenzofuran-7-yl-methylcarbamat (Carbofuran), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 186;
- (VII) 2,3-Dihydro-2,2-dimethylbenzofuran-7-yl-(dibutylaminothio)methylcarbamat (Carbosulfan), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 188;
- (VIII) S,S-(2-Dimethylaminotrimethylen)-bis(thiocarbamat) (Cartap), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 193;
- (IX) 1-[3,5-Dichlor-4-(3-chlor-5-trifluormethyl-2-pyridyloxy)phenyl]-3-(2,6-difluorbenzoyl)-harnstoff (Chlorfluzuron), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 213;
- (X) O,O-Diethyl-O-3,5,6-trichlor-2-pyridyl-phosphorthioat (Chlorpyrifos), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 235;
- (XI) (RS)- $\alpha$ -Cyano-4-fluor-3-phenoxybenzyl-(1RS,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-di-methylcyclopropancarboxylat (Cyfluthrin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 293;
- (XII) Gemisch aus (S)- $\alpha$ -Cyano-3-phenoxybenzyl-(Z)-(1R,3R)-3-(2-chlor-3,3,3-trifluorpropenyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat und (R)- $\alpha$ -Cyano-3-phenoxybenzyl-(Z)-(1R,3R)-3-(2-chlor-3,3,3-trifluorpropenyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat (Lambda-Cyhalothrin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 300;
- (XIII) Racemat, bestehend aus (S)- $\alpha$ -Cyano-3-phenoxybenzyl-(Z)-(1R,3R)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat und (R)- $\alpha$ -Cyano-3-phenoxybenzyl-(1S,3S)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat (Alpha-Cypermethrin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 308;
- (XIV) ein Gemisch aus Stereoisomeren von (S)- $\alpha$ -Cyano-3-phenoxybenzyl-(1RS,3RS,1RS,3RS)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat (zeta-Cypermethrin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 314;
- (XV) (S)- $\alpha$ -Cyano-3-phenoxybenzyl-(1R,3R)-3-(2,2-dibromvinyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat (Delta-methrin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 344;
- (XVI) (4-Chlorphenyl)-3-(2,6-difluorbenzoyl)harnstoff (Diflubenzuron), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 395;
- (XVII) (1,4,5,6,7,7-Hexachlor-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-ylenbismethylene)-sulfit (Endosulfan), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 459;
- (XVIII)  $\alpha$ -Ethylthio-o-tolyl-methylcarbamat (Ethiofencarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 479;
- (XIX) O,O-Dimethyl-O-4-nitro-m-tolyl-phosphorthioat (Fenitrothion), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 514;
- (XX) 2-sec-Butylphenyl-methylcarbamat (Fenobucarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 516;
- (XXI) (RS)- $\alpha$ -Cyano-3-phenoxybenzyl-(RS)-2-(4-chlorphenyl)-3-methylbutyrat (Fenvalerate), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 539;
- (XXII) S-[Formyl(methyl)carbamoylmethyl]-O,O-dimethyl-phosphordithioat (Formothion), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 625;
- (XXIII) 4-Methylthio-3,5-xylyl-methylcarbamat (Methiocarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 813;
- (XXIV) 7-Chlorbicyclo[3.2.0]hepta-2,6-dien-6-yl-dimethylphosphat (Heptenophos), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 670;
- (XXV) 1-(6-Chlor-3-pyridylmethyl)-N-nitroimidazolidin-2-ylidenamin (Imidacloprid), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 706;
- (XXVI) 2-Isopropylphenyl-methylcarbamat (Isoprocarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 729;
- (XXVII) O,S-Dimethyl-phosphoramidothioat (Methamidophos), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 808;
- (XXVIII) S-Methyl-N-(methylcarbamoyloxy)thioacetimidat (Methomyl), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 815;
- (XXIX) Methyl-3-(dimethoxyphosphinoyloxy)but-2-enoat (Mevinphos), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl.

(1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 844;  
(XXX) O,O-Diethyl-O-4-nitrophenyl-phosphorthioat (Parathion), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 926;  
(XXXI) O,O-Dimethyl-O-4-nitrophenyl-phosphorthioat (Parathion-methyl), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 928;  
(XXXII) S-6-Chlor-2,3-dihydro-2-oxo-1,3-benzoxazol-3-ylmethyl-O,O-diethyl-phosphordithioat (Phosalone), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 963;  
(XXXIII) 2-Dimethylamino-5,6-dimethylpyrimidin-4-yl-dimethylcarbamat (Pirimicarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 985;  
(XXXIV) 2-Isopropoxyphenyl-methylcarbamat (Propoxur), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1036;  
(XXXV) 1-(3,5-Dichlor-2,4-difluorphenyl)-3-(2,6-difluorbenzoyl)harnstoff (Teflubenzuron), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1158;  
(XXXVI) S-tert-Butylthiomethyl-O,O-dimethyl-phosphordithioat (Terbufos), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1165;  
(XXXVII) Ethyl-(3-tert-butyl-1-dimethylcarbamoyl-1H-1,2,4-triazol-5-yl-thio)-acetat, (Triazamate), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1224;  
(XXXVIII) Abamectin, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 3;  
(XXXIX) 2-sec-Butylphenyl-methylcarbamat (Fenobucarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 516;  
(XL) N-tert-Butyl-N-(4-ethylbenzoyl)-3,5-dimethylbenzohydrazid (Tebufenozide), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1147;  
(XLI) ( $\pm$ )-5-Amino-1-(2,6-dichlor- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluor-p-tolyl)-4-trifluormethylsulfinylpyrazol-3-carbonitril (Fipronil), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 545;  
(XLII) (RS)- $\alpha$ -Cyano-4-fluor-3-phenoxybenzyl(1RS,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat (beta-Cyfluthrin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 295;  
(XLIII) (4-Ethoxyphenyl)-[3-(4-fluor-3-phenoxyphenyl)propyl](dimethyl)silan (Silafluofen), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1105;  
(XLIV) tert-Butyl(E)- $\alpha$ -(1,3-dimethyl-5-phenoxy pyrazol-4-yl-methylenamino-oxy)-p-toluat (Fenpyroximate), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 530;  
(XLV) 2-tert-Butyl-5-(4-tert-butylbenzylthio)-4-chlorpyridazin-3(2H)-on (Pyridaben), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1161;  
(XLVI) 4-[[4-(1,1-Dimethylphenyl)phenyl]ethoxy]-chinazolin (Fenazaquin), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 507;  
(XLVII) 4-Phenoxyphenyl-(RS)-2-(pyridyloxy)propyl-ether (Pyriproxyfen), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1073;  
(XLVIII) 5-Chlor-N-{2-[4-(2-ethoxyethyl)-2,3-dimethylphenoxy]ethyl}-6-ethylpyrimidin-4-amin (Pyrimidifen), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1070;  
(XLIX) (E)-N-(6-Chlor-3-pyridylmethyl)-N-ethyl-N-methyl-2-nitrovinylidendiamin (Nitenpyram), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 880;  
(L) (E)-N<sup>1</sup>-[(6-Chlor-3-pyridyl)methyl]-N<sup>2</sup>-cyano-N<sup>1</sup>-methylacetamidin (NI-25, Acetamiprid), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 9;  
(LI) Avermectin B<sub>1</sub>, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 3;  
(LII) ein Insekten-aktives Extrakt aus einer Pflanze, speziell (2R,6aS,12aS)-1,2,6,6a,12,12a-Hexahydro-2-isopropenyl-8,9-dimethoxy-chromeno [3,4-b]furo[2,3-h]chromen-6-on (Rotenone), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1097; und ein Extrakt aus Azadirachta indica, speziell Azadirachtin, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 59; und  
(LIII) ein Präparat, das Insekten-aktive Nematoden enthält, bevorzugt Heterorhabditis bacteriophora und Heterorhabditis megidis, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 671; Steinemema feltiae, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1115 und Steinernema scapterisci, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1116;  
(LIV) ein Präparat, erhältlich von Bacillus subtilis, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 72; oder aus einem Stamm von Bacillus thuringiensis mit der Ausnahme von Verbindungen, isoliert aus GC91 oder aus NCTC11821; The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 73;

(LV) ein Präparat, das Insekten-aktive Fungi enthält, bevorzugt Verticillium lecanii, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1266; Beauveria brogniartii, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 85 und Beauveria bassiana, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 83;

(LVI) ein Präparat, das Insekten-aktive Viren enthält, bevorzugt Neodipridon Sertifer NPV, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1342; Mamestra brassicae NPV, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 759 und Cydia pomonella granulosis-Virus, aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 291;

(CLXXXI) 7-Chlor-2,3,4a,5-tetrahydro-2-[methoxycarbonyl(4-trifluormethoxyphenyl)carbamoyl]indol[1,2e]oxazolin-4a-carboxylat (DPX-MP062, Indoxycarb), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 453;

(CLXXXII) N-tert-Butyl-N'-(3,5-dimethylbenzoyl)-3-methoxy-2-methylbenzohydrazid (RH-2485, Methoxyfenozide), aus The Pesticide Manual, 11. Aufl. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1094; und

(CLXXXIII) (N'-[4-Methoxy-biphenyl-3-yl]-hydrazincarbonsäureisopropylester (D 2341), aus Brighton Crop Protection Conference, 1996, 487–493; (R2) Book of Abstracts, 212. ACS National Meeting Orlando, FL, 25.–29. August (1996), AGRO-020. Herausgeber: American Chemical Society, Washington, D. C. CONEN: 63BFAF.

**[0033]** In der Regel enthalten die anhelminthischen Zusammensetzungen der Erfindung 0,1 bis 99 Gew.-%, speziell 0,1 bis 95 Gew.-% Wirkstoff der Formel I, Ia oder Gemische davon, 99,9 bis 1 Gew.-%, speziell 99,8 bis 5 Gew.-% einer festen oder flüssigen Beimischung, einschließlich 0 bis 25 Gew.-%, speziell 0,1 bis 25 Gew.-% eines oberflächenaktiven Mittels.

**[0034]** Die Verabreichung der Zusammensetzungen gemäß der Erfindung an die Tiere, die behandelt werden sollen, kann topisch, peroral, parenteral oder subkutan stattfinden, wobei die Zusammensetzung in Form von Lösungen, Emulsionen, Suspensionen (Beizen), Pulvern, Tabletten, großen Pillen, Kapseln und Aufgießformulierungen vorliegt.

**[0035]** Das Aufgieß- oder Spot-on-Verfahren besteht aus dem Applizieren der Verbindung der Formel I auf eine spezielle Stelle der Haut oder Deckschicht, vorteilhafterweise auf den Nacken oder das Rückgrat des Tieres. Dies findet beispielsweise durch Applizieren eines Tupfens oder Sprays der Aufgieß- oder Spot-on-Formulierung auf eine relativ kleine Fläche der Deckschicht statt, von wo der Wirkstoff beinahe automatisch über breite Flächen des Pelzes wegen des sich ausbreitenden Wesens der Komponenten in der Formulierung und unterstützt durch die Bewegungen des Tieres verteilt wird.

**[0036]** Aufgieß- oder Spot-on-Formulierungen enthalten geeigneterweise Träger, die die schnelle Verteilung über die Hautoberfläche oder in der Deckschicht des Wirtstieres fördern, und werden im allgemeinen als Ausbreitungsöle betrachtet. Geeignete Träger sind beispielsweise ölige Lösungen; alkoholische und isopropanolische Lösungen, wie Lösungen aus 2-Octyldodecanol oder Oleylalkohol; Lösungen in Estern von Monocarbon-säuren, wie Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Laurinsäureoxalat, Ölsäureoleylester, Ölsäuredecylester, Hexyllaurat, Oleyloleat, Decyloleat, Decansäureester von gesättigten Fettsäuren mit einer Kettenlänge von C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>; Lösungen aus Estern von Dicarbonsäuren, wie Dibutylphthalat, Diisopropylisophthalat, Adipinsäuredi-isopropylester, Di-n-butyladipat oder ebenso Lösungen von Estern von aliphatischen Säuren, beispielsweise Glykolen. Es kann vorteilhaft sein, daß ein zusätzliches Dispergiermittel vorliegt, wie eines, das aus der Pharmazie und Kosmetik bekannt ist. Beispiele sind 2-Pyrrolidon, 2-(N-Alkyl)pyrrolidon, Aceton, Polyethylenglykol und die Ether und Ester davon, Propylenglykol oder synthetische Triglyceride.

**[0037]** Die ölichen Lösungen umfassen beispielsweise Pflanzenöle, wie Olivenöl, Erdnußöl, Sesamöl, Kienöl, Leinsamenöl oder Rizinusöl. Die Pflanzenöle können ebenso in epoxidierter Form vorliegen. Paraffine und Silikonöle können ebenso verwendet werden.

**[0038]** Eine Aufgieß- oder Spot-on-Formulierung enthält im allgemeinen 1 bis 20 Gew.-% einer Verbindung der Formel I, 0,1 bis 50 Gew.-% Dispergiermittel und 45 bis 98,9 Gew.-% Lösungsmittel.

**[0039]** Das Aufgieß- oder Spot-on-Verfahren ist besonders vorteilhaft für die Verwendung bei Herdentieren, wie Rindvieh, Pferde, Schafe oder Schweine, wobei es schwierig oder zeitaufwendig ist, alle Tiere oral oder durch Injektion zu behandeln. Aufgrund seiner Einfachheit kann dieses Verfahren natürlich ebenso für alle anderen Tiere verwendet werden, einschließlich einzelne Haustiere oder Heimtiere, und wird größtenteils von den Haltern der Tiere bevorzugt, da es oftmals ohne die Gegenwart des Tierarztes durchgeführt werden kann.

**[0040]** Während es bevorzugt ist, kommerzielle Produkte als Konzentrate zu formulieren, wird der Endverbraucher normalerweise verdünnte Formulierungen verwenden.

**[0041]** Diese Zusammensetzungen können ebenso weitere Additive enthalten, wie Stabilisatoren, Antischaummittel, Viskositätsregulatoren, Bindemittel oder Verdickungsmittel, sowie andere Wirkstoffe, um die speziellen Wirkungen zu erreichen.

**[0042]** Anthelminthische Zusammensetzungen von diesem Typ, die durch den Endverbraucher verwendet werden, bilden ebenso einen Bestandteil der vorliegenden Erfindung.

**[0043]** In jedem der Verfahren gemäß der Erfindung zur Schädlingsbekämpfung oder in jeder der Schädlingsbekämpfungszusammensetzungen gemäß der Erfindung können die Wirkstoffe der Formel I in all ihren sterischen Konfigurationen oder in Gemischen davon verwendet werden.

**[0044]** Die Erfindung umfaßt ebenso eine pharmazeutische Zusammensetzung für den prophylaktischen Schutz von Warmbluttieren, speziell Nutzvieh, Haustieren und Heimtieren, gegen parasitische Helminthen, dadurch gekennzeichnet, daß die Wirkstoffe der Formel I oder die daraus hergestellten Wirkstoffformulierungen den Tieren als ein Additiv zum Futter oder dem Trinkwasser oder ebenso in fester oder flüssiger Form, oral oder durch Injektion oder parenteral verabreicht werden.

**[0045]** Die folgenden Beispiele dienen zur Illustration der Erfindung, der Ausdruck Wirkstoff stellt eine Substanz dar, die in den Tabellen 1 bis 2 aufgelistet ist.

**[0046]** Insbesondere werden die bevorzugten Formulierungen folgendermaßen hergestellt: (% = Gew.-%)

#### Formulierungsbeispiele

<u>1. Granulat</u>	a)	b)
Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	5 %	10 %
Kaolin	94%	-
hochdisperse Kieselsäure	1 %	-
Attapulgit	-	90 %

**[0047]** Der Wirkstoff wurde in Methylchlorid gelöst, auf den Träger gesprührt und das Lösungsmittel anschließend durch Eindampfung unter Vakuum konzentriert. Granulate von dieser Art können mit dem Tierfutter gemischt werden.

#### 2. Granulat

Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	3 %
Polyethylenglykol (mw 200)	3 %
Kaolin	94 %
(mw = Molekulargewicht)	

**[0048]** Der fein zerkleinerte Wirkstoff wurde gleichmäßig in einem Mischer auf das Kaolin aufgebracht, das mit Polyethylenglykol befeuchtet worden ist. In dieser Weise wurden staubfreie beschichtete Granulate erhalten.

## 3. Tabletten oder große Pillen

I Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	33,00 %
Methylcellulose	0,80 %
Kieselsäure, hoch dispers	0,80 %
Maisstärke	8,40 %
II Laktose, krist.	22,50 %
Maisstärke	17,00 %
mikrokrist. Cellulose	16,50 %
Magnesiumstearat	1,00 %

I Methylcellulose wurde in Wasser gerührt. Nachdem die Materialien quollen, wurde Kieselsäure eingerührt und das Gemisch homogen suspendiert. Der Wirkstoff und die Maisstärke wurden gemischt. Die wässrige Suspension wurde in dieses Gemisch eingearbeitet und zu einem Teig geknetet. Die resultierende Masse wurde durch ein 12 M Sieb granuliert und getrocknet.

II Alle 4 Trägerstoffe wurden gründlich gemischt.

III Die vorbereitenden Mischungen, erhalten gemäß I und II, wurden gemischt und zu Tabletten oder großen Pillen gepreßt.

## 4. Injektionsmittel

## A. Öliges Vehikel (langsame Freisetzung)

1. Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	0,1–1,0 g
Erdnußöl	ad 100 ml
2. Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	0,1–1,0 g
Sesamöl	ad 100 ml

**[0049]** Präparat: Der Wirkstoff wurde in Teilen des Öls während des Röhrens und, wenn erforderlich, unter vorsichtigem Erhitzen gelöst, dann nach dem Abkühlen auf das gewünschte Volumen gebracht und steril durch einen geeigneten Membranfilter mit einer Porengröße von 0,22 mm filtriert.

## B. Wassermischbares Lösungsmittel (durchschnittliche Freisetzungsraten)

Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	0,1–1,0 g
4-Hydroxymethyl-1,3-dioxolan (Glycerolformal)	40 g
1,2-Propandiol	ad 100 ml
ein Wirkstoff aus Tabelle 1	0,1–1,0 g
Glyceroldimethylketal	40 g
1,2-Propandiol	ad 100 ml

**[0050]** Präparat: Der Wirkstoff wurde in einem Teil des Lösungsmittels während des Röhrens gelöst, auf das gewünschte Volumen gebracht und steril durch eine geeignete Filtermembran mit einer Porengröße von 0,22 mm filtriert.

## C. Wässriger Solubilisat (schnelle Freisetzung)

1. Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2 polyethoxyliertes Rizinusöl (40 Ethylenoxideinheiten)	0,1–1,0 g 10 g
1,2-Propandiol	20 g
Benzylalkohol	1 g
Wasser zur Injektion	ad 100 ml
2. Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2 polyethoxyliertes Sorbitanmonooleat (20 Ethylenoxideinheiten)	0,1–1,0 g 8 g
4-Hydroxymethyl-1,3-dioxolan (Glycerolformal)	20 g
Benzylalkohol	1 g
Wasser zur Injektion	ad 100 ml

**[0051]** Präparat: Der Wirkstoff wurde in den Lösungsmitteln und dem oberflächenaktiven Mittel gelöst, und mit Wasser auf das gewünschte Volumen gebracht. Sterile Filtration durch einen geeigneten Membranfilter mit einer Porengröße von 0,22 mm.

## 5. Aufguß

A.

Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	5 g
Isopropylmyristat	10 g
Isopropanol	ad 100 ml

B.

Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	2 g
Hexyllaurat	5 g
mittelkettiges Triglycerid	15 g
Ethanol	ad 100 ml

C.

Wirkstoff aus Tabellen 1 und 2	2 g
Oleyloleat	5 g
N-Methylpyrrolidon	40 g
Isopropanol	ad 100 ml

**[0052]** Die wässrigen Systeme können ebenso bevorzugt zur oralen und/oder intraruminalen Verabreichung verwendet werden.

**[0053]** Die Zusammensetzungen können ebenso weitere Additive enthalten, wie Stabilisatoren, beispielsweise wo geeignet, epoxidierte Pflanzenöle (epoxidiertes Kokosnussöl, Rapsöl oder Sojabohnenöl); Antischäummittel, beispielsweise Siliconöl, Konservierungsmittel, Viskositätsregulatoren, Bindemittel und Verdickungsmittel, sowie Düngemittel oder andere Wirkstoffe, um die speziellen Wirkungen zu erreichen.

**[0054]** Weitere biologische aktive Substanzen oder Additive, die gegenüber den Verbindungen der Formel I neutral sind und keine schädliche Wirkung auf das Wirtstier, das behandelt werden soll, ausüben, sowie Mineralsalze oder Vitamine können ebenso zu den beschriebenen Zusammensetzungen zugegeben werden.

## Biologische Beispiele:

1. In-vivo-Test an *Trichostrongylus colubriformis* und *Haemonchus contortus* auf mongolischen Wüstenmäusen (*Meriones unguiculatus*) unter Verwendung von peroraler Verabreichung

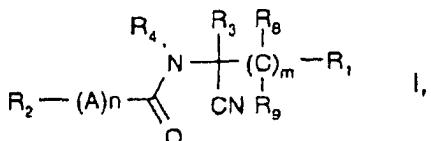
**[0055]** Sechs bis acht Wochen alte mongolische Wüstenmäuse werden unter künstlicher Ernährung mit ca. 2000 Larven im dritten Stadium jeweils von *T. colubriformis* und *H. contortus* infiziert. 6 Tage nach der Infektion werden die Wüstenmäuse leicht mit N<sub>2</sub>O anästhetisiert und durch perorale Verabreichung mit den Testverbindungen, gelöst in einem Gemisch aus 2 Teilen DMSO und 1 Teil Polyethylenglykol (PEG 300), in Mengen von 100, 32 und 10–0,1 mg/kg behandelt. An Tag 9 (3 Tage nach der Behandlung), wenn die meisten der *H. contortus*, die noch vorliegen, späte Larven des 4. Stadiums sind und die meisten der *T. colubriformis* unentwickelte Adulste sind, werden die Wüstenmäuse getötet, um die Würmer zu zählen. Die Wirksamkeit wird als die

%-Verringerung der Anzahl an Würmern in jeder Wüstenmaus im Vergleich zu dem geometrischen Durchschnitt der Anzahl an Würmern von 8 infizierten und nicht-behandelten Wüstenmäusen berechnet.

**[0056]** In diesem Test wird eine rasche Verringerung des Nematodenbefalls mit den Verbindungen der Formel I erreicht.

### Patentansprüche

#### 1. Verwendung von Verbindungen der Formel I



worin

R<sub>1</sub> substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylen bedeutet, wobei die Substituenten aus der Gruppe ausgewählt sind, umfassend unsubstituiertes Aryloxy oder Aryloxy, das durch R; mono- bis pentasubstituiert ist, und unsubstituiertes Pyridyloxy oder Pyridyloxy, das durch R<sub>5</sub> mono- bis tetra-substituiert ist, wobei die Substituenten dieselben oder unterschiedlich sein können, wenn ihre Anzahl größer als 1 ist;

R<sub>2</sub> unsubstituiertes Phenyl oder Phenyl, das durch R<sub>5</sub> mono- bis penta-substituiert ist, oder unsubstituiertes Pyridyl oder Pyridyl, das durch R<sub>5</sub> mono- bis tetra-substituiert ist, bedeutet;

R<sub>3</sub> Methyl ist;

R<sub>4</sub> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl bedeutet;

R<sub>5</sub> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Akkoxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, Halogen-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, Halogen-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy carbonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, Halogen, Cyan oder Nitro bedeutet;

A C(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>), CH=CH oder C≡C bedeutet;

R<sub>6</sub> und R<sub>7</sub> entweder unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl bedeuten; oder zusammen C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen bedeuten;

R<sub>8</sub> und R<sub>9</sub> Wasserstoff sind;

m und n unabhängig voneinander 0 oder 1 sind;

und gegebenenfalls Enantiomeren davon,

mit der Maßgabe, daß, wenn m 0 ist, dann R<sub>1</sub> erhalten bleibt;

bei der Herstellung einer pharmazeutischen Zusammensetzung zur Bekämpfung von endoparasitischen Helminthen bei warmblütigem Nutzvieh und Haustieren.

2. Verwendung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, wobei die Helminthen endoparasitische Nematoden sind.

3. Verwendung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 2, wobei die endoparasitischen Nematoden von der Gattung Haemonchus, Trichostrongylus, Ostertagia, Nematodirus, Cooperia, Ascaris, Bunostonum, Oesophagostonum, Charbertia, Trichuris, Strongylus, Trichonema, Dictyocaulus, Capillaria, Heterakis, Toxocara, Ascaridia, Oxyuris, Ancylostoma, Uncinaria, Toxascaris oder Parascaris sind.

4. Zusammensetzung zur Bekämpfung der endoparasitischen Helminthen bei warmblütigem Nutzvieh und Haustieren nach Anspruch 1, die als Wirkstoff mindestens eine Verbindung der Formel I nach Anspruch 1 zusätzlich zu Trägern und/oder Dispergiermitteln enthält.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen