

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
11. Oktober 2018 (11.10.2018)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2018/184978 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 405/12 (2006.01) A01N 43/50 (2006.01)
C07D 239/42 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2018/058081

(22) Internationales Anmeldedatum:
29. März 2018 (29.03.2018)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
17164918.9 05. April 2017 (05.04.2017) EP

(71) Anmelder: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim am Rhein (DE). BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder: JAKOBI, Harald; Großer Hasenpfad 80, 60598 Frankfurt (DE). BUSCATO, ARSEQUELL, Estella; Europa-Allee 138, 60486 Frankfurt am Main (DE). MINN, Klemens; Rossertstr. 61, 65795 Hattersheim (DE). DÖLLER, Uwe; Christian-Morgensternstr. 11, 63110 Rodgau (DE). DIETRICH, Hansjörg; Bonifatiusstr. 1b, 65835 Liederbach am Taunus (DE). GATZWEILER, Elmar; Am Nauheimer Bach 22, 61231 Bad Nauheim (DE). MACHETTIRA, Anu, Bheemaiah; Niedernhausener Str. 47, 60326 Frankfurt am Main (DE). ROSINGER, Christopher, Hugh; Am Hochfeld 33, 65719 Hofheim (DE). SCHMUTZLER, Dirk; Hauptmannweg 2, 65795 Hattersheim (DE).

(74) Anwalt: BIP PATENTS; Alfred-Nobel-Str. 10, 40789 Monheim am Rhein NRW (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN,

KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

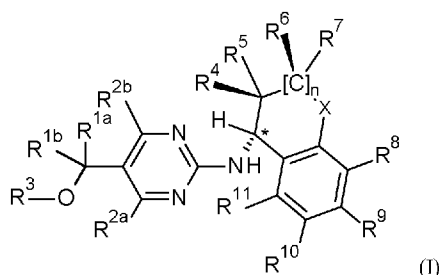
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)

(54) Title: 2-AMINO-5-OXYALKYL-PYRIMIDINE DERIVATIVES AND THEIR USE FOR CONTROLLING UNDESIRE PLANT GROWTH

(54) Bezeichnung: 2-AMINO-5-OXYALKYL-PYRIMIDINDERIVATE UND DEREN VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG UNERWÜNSCHTEN PFLANZENWACHSTUMS



(57) Abstract: The invention relates to compounds of the common formula (I) and to the agrochemically compatible salts thereof, to the production and use thereof in the field of plant protection.

(57) Zusammenfassung: Beschrieben werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren agrochemisch-verträglichen Salze sowie deren Herstellung und Verwendung im Bereich des Pflanzenschutzes.



WO 2018/184978 A1

2-Amino-5-Oxyalkyl-Pyrimidinderivate und deren Verwendung zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwachstums

5 Beschreibung

Die Erfindung betrifft das technische Gebiet der Pflanzenschutzmittel, insbesondere das der Herbizide zur selektiven Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen sowie im Ziergartenbereich und zur generellen Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Umweltbereichen, in denen Pflanzenwuchs störend ist.

10 Insbesondere betrifft die Erfindung substituierte 2-Amino-5-oxyalkyl-Pyrimidinderivate, Verfahren zu deren Herstellung sowie deren Verwendung zur Bekämpfung von Schadpflanzen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) weisen in der 5-Position des Pyrimidins eine Oxyalkyl-Gruppe und in der 2-Position des Pyrimidins einen in der alpha Position zum Aromaten über ein Amin gebundenen teilhydrierten bicyclischen Substituenten auf, wobei das Pyrimidin in der 4-
15 Position und 6-Position ebenfalls substituiert sein kann und die Oxyalkyl-Gruppe über den Alkylrest zusammen mit dem Substituenten in der benachbarten Position einen Ring bilden kann.

Aus dem Stand der Technik ist die herbizide Wirkung von Diaminopyrimidinen und auch von Monoaminopyrimidinen bereits bekannt.

2.4-Diaminopyrimidine und deren Anwendung im Bereich des Pflanzenschutzes werden beispielsweise
20 durch die Dokumente EP 0523533 A1, WO 2010/076009 A1 und WO 2010/076010 A1 offenbart. 2.4-Diaminopyrimidine mit bicyclischem Rest, welche am verbrückten und am benachbarten Kohlenstoffatom eine (1R, 2S)-Konfiguration aufweisen und sich zugleich durch eine herbizide Wirksamkeit auszeichnen, sind aus US 2010/0167934 A1 bekannt.

Weitere Diaminopyrimidine, nämlich substituierte Furano-/Thienocycloalkylamino-2-Pyrimidinderivate
25 offenbart das Dokument WO 2017/016914 A1. Der Pyrimidinring dieser Furano-/Thienocycloalkylamino-2-Pyrimidinderivate kann, neben dem Amin substituenten in 2-Position, zusätzliche Aminoreste in der 4-, 5-, oder in der 6-Position aufweisen. Mit den unter Anspruch 1 fallenden Verbindungen, unterscheidet sich der Gegenstand der vorliegenden Anmeldung von den aus WO
30 2017/016914 A1 bekannten Verbindungen durch einen kondensierten Phenylring. Die aus WO 2017/016914 A1 bekannten Verbindungen weisen statt dessen einen kondensierten Thiophenring auf. Die durch diesen Unterschied bewirkte Verbesserung der herbiziden Wirkung ist durch Vergleichsdaten in den Tabellen 4a und 4b zusammengefasst.

Monaminopyrimidinderivate mit herbizider Wirkung, nämlich 5-Amino-Pyrimidinderivate, sind beispielsweise in Dokument WO 2013/144187 A1 offenbart. Andere Monaminopyrimidinderivate mit herbizider Wirkung, nämlich 2-Amino-5-Keto-Pyrimidinderivate, werden in Dokument WO 2016/001118 A1 offenbart. Die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen bewirkte Verbesserung der herbiziden Wirkung wird durch die in den Tabellen 3a und 3b zusammengefassten Vergleichsdaten belegt.

Weitere 2-Amino-Pyrimidinderivate, nämlich 2-Amino-5-Ketoxim-Pyrimidinderivate, sind Gegenstand der noch nicht offengelegten Anmeldung mit der Anmeldenummer PCT/EP2016/081655. Diese Anmeldung ist nach ihrer Offenlegung in Bezug auf die vorliegende Anmeldung ein Dokument gem. Art. 54 (3) EPÜ.

Die Anwendung der bekannten Pyrimidinderivate als selektive Herbizide zur Schadpflanzenbekämpfung oder als Pflanzenwachstumsregulatoren in verschiedenen Nutzpflanzenkulturen erfordert jedoch häufig eine hohe Kosten verursachende Aufwandmenge oder führt zu unerwünschten Schädigungen der Nutzpflanzen. Zudem ist die Anwendung der Wirkstoffe in vielen Fällen wegen verhältnismäßig hoher Herstellkosten unwirtschaftlich.

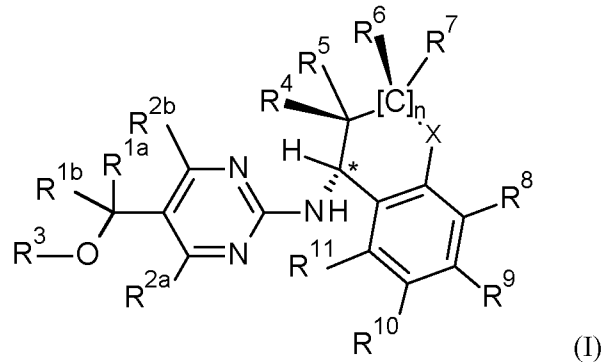
Es ist deshalb erstrebenswert, alternative chemische Wirkstoffe auf Basis von Pyrimidinderivaten bereitzustellen, die als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren eingesetzt werden können und mit welchen bestimmte Vorteile im Vergleich zu aus dem Stand der Technik bekannten Systemen verbunden sind.

Die Aufgabe der vorliegenden Erfindung besteht in der Bereitstellung alternativer Pyrimidin-Derivate, welche als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren, mit einer zufriedenstellenden herbiziden Wirkung und einem breiten Wirkspektrum gegenüber Schadpflanzen und/oder mit einer hohen Selektivität in Nutzpflanzenkulturen, eingesetzt werden können.

Außerdem zeigen die alternativen Pyrimidin-Derivate im Vergleich zu den aus dem Stand der Technik bekannten Pyrimidinderivaten ein besseres Eigenschaftsprofil, insbesondere zeigen sie eine bessere herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen, ein breiteres Spektrum gegenüber Schadpflanzen und/oder eine höhere Selektivität in Nutzpflanzenkulturen.

Gelöst wird die Aufgabe durch speziell substituierte 2-Amino-5-Oxyalkyl-Pyrimidinderivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, welche insbesondere aufgrund der Substitution in 5-Position des Pyrimidinrings vorteilhaft als Herbizide und auch als Pflanzenwachstumsregulatoren eingesetzt werden können. Die Substitution in 5-Position des Pyrimidinrings betrifft die Gruppe, welche die Reste R^3 -O-C, R^{1a} und R^{1b} umfasst.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher Verbindungen der Formel (I)



und deren agrochemisch verträglichen Salze, in welchen

- 5 R^{1a} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus
- Wasserstoff, Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂;
 - (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;
 - (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- 10
- (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl;
 - (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl;
 - (C₆-C₁₄)-Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - Pyridyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein
- 15
- können;
 - Thienyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- 20
- Aminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl;
 - (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl;

- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
 - Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, Amino-(C₁-C₆)-alkyl, Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
 - (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- R^{1b} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus
- Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂;
 - (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;
 - (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
 - (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl;
 - (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl;
 - (C₆-C₁₄)-Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - Pyridyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - Thienyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - Aminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl;

- (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- 5 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, Amino-(C₁-C₆)-alkyl, Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;

wobei, falls R^{1a} ungleich Wasserstoff ist, R^{1a} mit R^{1b} über eine Bindung miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff, an dem diese beiden Reste gebunden sind, ein gesättigter oder ungesättigter 3 bis 7 gliedriger Carbo- oder Heterocyclus entsteht, der unsubstituiert ist oder substituiert ist mit einem oder mehreren Substituenten ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, spiro-(C₃-C₆)-Cycloalkyl;

R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus

- 20 - Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂;
- (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)-Halogenalkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Halogenalkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- 25 - (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl, (C₂-C₆)-Alkenylcarbonyl, (C₂-C₆)-Haloalkenylcarbonyl, (C₂-C₆)-Alkenyloxy, (C₂-C₆)-Haloalkenyloxy, (C₂-C₆)-Alkenyloxycarbonyl, (C₂-C₆)-Haloalkenyloxycarbonyl;
- (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl, (C₂-C₆)-Alkynylcarbonyl, (C₂-C₆)-Haloalkynylcarbonyl,

- (C₂-C₆)-Alkinyloxy, (C₂-C₆)-Haloalkinyloxy, (C₂-C₆)-Alkinyloxycarbonyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinyloxycarbonyl; Tri-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkinyl, Di-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkinyl, Mono-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkinyl; Phenylsilyl-(C₂-C₆)-alkinyl;
- 5 - (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₆-C₁₄)-Aryloxy, (C₆-C₁₄)-Arylcarbonyl und (C₆-C₁₄)-Aryloxycarbonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl-carbonyl, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl-carbonyloxy, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyloxy;
- 10 - Aminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, Di-(C₁-C₆)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl;
- N-((C₁-C₆)-Haloalkanoyl)-amino-carbonyl, Mono-((C₆-C₁₄)-aryl)-amino-carbonyl, Di-((C₆-C₁₄)-aryl)-amino-carbonyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy;
- 15 - (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert ist; (C₃-C₈)-Cycloalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy;
- 20 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy;
- 25 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy;
- 30 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy;

- Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, Hydroxy-(C₁-C₆)-alkoxy, Cyano-(C₁-C₆)-alkoxy, Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
 - (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Alkylthio, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Halogenalkylthio, (C₁-C₆)-Halogenalkylsulfinyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)-Halogenalkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)-Alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)-Alkylthiocarbonyloxy, (C₁-C₆)-Haloalkylthiocarbonyloxy, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy; (C₄-C₁₄)-Arylsulfonyl, (C₆-C₁₄)-Arylthio, (C₆-C₁₄)-Arylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₃-C₈)-Alkenylthio, (C₃-C₈)-Cycloalkenylthio und (C₃-C₆)-Alkinylthio;
- 15 R³ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus
- Wasserstoff;
 - (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylcarbonyl;
 - (C₂-C₆)-Alkenylcarbonyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenylcarbonyl;
 - (C₂-C₆)-Alkinylcarbonyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinylcarbonyl;
- 20 - (C₆-C₁₄)-Arylcarbonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- Aminocarbonyl, [(C₁-C₆)-Alkylamino]carbonyl, [Di-(C₁-C₆)-Alkylamino]carbonyl;
 - (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl, (C₂-C₆)-Alkenyloxycarbonyl, (C₂-C₆)-Alkinyloxycarbonyl;
 - (C₁-C₆)-Trialkylsilyl;
- 25 - (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl;
- (C₆-C₁₄)-Arylsulfonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;

- (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl;
- (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl; Tri-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl, Di-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl, Mono-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl; Phenylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl;
- 5 - (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- (C₆-C₁₄)-Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- (C₂-C₁₄)-Het-Aryl, welche jeweils am Het-Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- 10 - (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- Aminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann;
- 15 - (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- 20
- 25 R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, Hydroxy, (C₁-C₆)-Alkoxy und (C₁-C₆)-Halogenalkoxy; oder
die Reste R⁴ und R⁵ bilden zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an welchem sie gebunden

sind, einen drei- bis siebengliedrigen Ring;

5 R^6 und R^7 jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Halogenalkoxy, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₆-C₁₄)-Aryloxy, (C₆-C₁₄)-Arylcarbonyl und (C₆-C₁₄)-Aryloxycarbonyl; oder

die Reste R^6 und R^7 bilden zusammen eine (C₁-C₇)-Alkylengruppe, die ein oder mehrere Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthalten kann, wobei die (C₁-C₇)-Alkylengruppe durch Halogen einfach oder mehrfach substituiert sein kann und die jeweiligen Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können;

10 n die Laufzahl 0, 1 oder 2 ist;

15 R^8 , R^9 , R^{10} und R^{11} jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Alkyloxycarbonyl, (C₁-C₆)-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)-di-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Halogenalkoxy, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl, (C₂-C₆)-Alkynylcarbonyl, (C₂-C₆)-Haloalkynylcarbonyl, (C₂-C₆)-Alkinyloxy, (C₂-C₆)-Haloalkinyloxy, (C₂-C₆)-Alkinyloxycarbonyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinyloxycarbonyl, (C₆-C₁₄)-Aryl und Nitro, wobei die Reste R^9 und R^{10} ringbildend durch eine -O-CH₂-O- Gruppe verbunden sein können;

20 X für eine Bindung, CH₂, O, S, Carbonyl, NH, CR¹²R¹³, NR¹⁴, CH₂O oder CH₂S steht, wobei bei den beiden letztgenannten Gruppen das Kohlenstoffatom an den aromatischen Teil und das Heteroatom O oder S an den teilhydrierten Teil desamins gebunden ist;

R^{12} und R^{13} jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl und (C₁-C₆)-Haloalkyl; und

25 R^{14} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl und (C₁-C₆)-Haloalkyl.

Die erfindungsgemäßen 2-Amino-5-Oxyalkyl-Pyrimidinderivate der Formel (I) unterscheiden sich von den aus dem Stand der Technik bekannten Diamino-Pyrimidinderivaten (z.B. die aus den Dokumenten EP 0523533 A1, WO 2010/076009 A1 und WO 2010/076010 A1 bekannten Herbiziden mit 2,4-Diaminopyrimidin-Struktur) in der Zahl der mit einem Ringatom des Pyrimidinrings direkt verbundenen Amino-Gruppen. Die Vergleichsdaten der nachfolgenden Tabellen 1 und 2 betreffen die aus WO 30 2010/076010 A1 bekannten Diamino-Pyrimidinderivate.

Bei den erfindungsgemäßen Monoaminopyrimidinen der Formel (I) stehen die beiden Reste R^{2a} und R^{2b} also nicht für eine Aminogruppe, d.h. die R^{2a} und R^{2b} sind nicht über ein Stickstoffatom mit dem Pyrimidinring verbunden. Die erfindungsgemäßen 2-Amino-5-oxyalkyl-pyrimidine sind durch nur eine Aminogruppe substituiert, wobei diese Aminogruppe den Pyrimidinring und den bicyclischen
5 Substituenten miteinander verbindet.

Von den vorbekannten Pyrimidinen mit nur einem Aminosubstituenten (Monoaminopyrimidinen) (z.B. aus Dokument WO 2013/144187 A1) unterscheiden sich die erfindungsgemäßen 2-Amino-5-oxyalkyl-pyrimidine der Formel (I) der vorliegenden Erfindung dagegen dadurch, dass die Aminogruppe in 2-Position, d.h. zwischen den beiden zum Pyrimidinring gehörenden Stickstoffatomen, und nicht in 5-
10 Position, angeordnet ist.

Die Aminogruppe in der 2-Position des Pyrimidins weist bei den erfindungsgemäßen Monoaminopyrimidinen der Formel (I) einen teilhydrierten bicyclischen Substituenten auf, wobei der teilhydrierte bicyclische Substituent in der alpha Position zum Aromaten an das Amin gebunden ist.

Die oben genannten, in Dokument WO 2016/001118 A1 offenbarten 2-Amino-5-Keto-Pyrimidinderivate,
15 sowie die 2-Amino-5-Ketoxim-Pyrimidinderivate, die Gegenstand noch nicht offengelegten oben genannten Anmeldung mit der Anmeldenummer PCT/EP2016/081655 sind, stimmen mit den erfindungsgemäßen Monoaminopyrimidinen der Formel (I) in der Zahl und in der Positionierung der Aminogruppe am Pyrimidinring überein.

Jedoch unterscheiden sich die erfindungsgemäßen Monoaminopyrimidine der Formel (I) von den beiden
20 vorgenannten 2-Amino-Pyriminderivaten dadurch, dass sie in 5-Position keine Keto-Gruppe (Carbonyl-Gruppe), bzw. kein Ketoxim-Strukturelement aufweisen. D.h. die Gruppe der Strukturelemente in 5-Position der erfindungsgemäßen Verbindungen, welche die Reste R^3 -O-C, R^{1a} und R^{1b} umfasst und zusammen eine Oxyalkyl-Gruppe bilden, zeichnen sich dadurch aus, dass sie kein Carbonyl- und kein Ketoxim-Strukturelement aufweisen. Die Vergleichsdaten der nachfolgenden Tabellen 3 und 4
25 betreffen die aus WO 2016/001118 A1 bekannten Monoamino-Pyrimidinderivate.

Die überraschend gute herbizide Wirkung der erfindungsgemäßen Verbindungen im Vergleich zu den analogen Diaminopyrimidinen aus WO 2010/076010 A1 sowie im Vergleich zu den aus WO 2016/001118 A1 bekannten Monoaminopyrimidinen wird belegt, durch die in den nachfolgenden 4 Tabellen gegenübergestellten Vergleichspaare.

Tabelle 1: Vergleich der herbiziden Wirkung im Voraufbau von erfindungsgemäßen Verbindungen mit Verbindungen aus WO 2010/076010 A1

Beispiel-Nr. oder Anmeldungs-Nr.	Dosierung [g/ha]	Herbizide Wirkung gegen [%]													
		ALOMY	AVEFA	CYPES	ECHCG	LORLI	SETVI	ABUTH	AMARE	PHBPU	POLCO	STEME	VIOTR	HORMU	
1.4	320	100	100	100				100		100					
	80	90	80	80	100	100	100	100	100	80	100				90
WO 2010/076010 A1	320	60	10	70			60			0					
	80	30	10	60	30	40	20	40	0	0					20

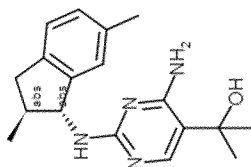
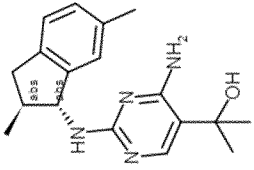
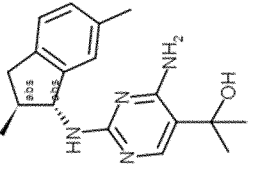
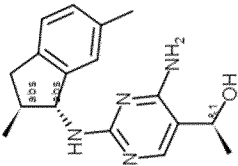
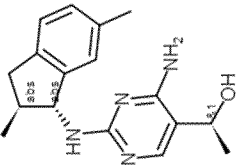


Tabelle 2: Vergleich der herbiziden Wirkung im Nachauflauf von erfindungsgemäßen Verbindungen mit Verbindungen aus WO 2010/076010 A1

Beispiel-Nr. oder Anmeldungs-Nr.	Dosierung [g/ha]	Herbizide Wirkung gegen [%]													
		ALOMY	AVEFA	ECHCG	LORRI	SETVI	ABUTH	AMARE	MATIN	PHBPU	POLCO	STEME	VIOTR	VERPE	HORMU
1.4	320	70	50	90	90	80		100	80	100	90	90			
	80	20	20	30	60		60		40		70	60	90		
WO 2010/076010 A1 	320	10	0	10	0	30		70	60	50	0	0			
	80	0	0	0	0		30		0		0	0	60		
1.6	320	100	100	100	100	100		100		100	100	100			
	80	90		100	40	90	80	100	20		80	100	90		
WO 2010/076010 A1 	320	10	0	10	0	30		70		50	0	0			
	80	0		0	0		30		0		0	60			

Beispiel-Nr. oder Anmeldungs-Nr.	Dosierung [g/ha]	Herbizide Wirkung gegen [%]													
		ALOMY	AVEFA	ECHCG	LOLRI	SETVI	ABUTH	AMARE	MATIN	PHBPU	POLCO	STEME	VIOTR	VERPE	HORMU
1.7	320	100			100		80			100	80				100
	80	80		20	100	60			60	80	80				40
WO 2010/076010 AI 	320	70			70	60			80	60	60				20
	80	0		0	60	10			20	60	60				0
1.2	320		80				80				90				
	80		60	40					40	90	90				
WO 2010/076010 AI 	320		50			60				60	60				
	80		0	0					20	60	70				

Die in Tabelle 1 (Vorauslauf) und die in Tabelle 2 (Nachlauf) vergleichend gegenübergestellten herbiziden Wirkungen belegen das gute Wirksamkeitsprofil der erfindungsgemäßen Verbindungen 1.4 und 1.6 sowie 1.7 und 1.2 im Vergleich zu den aus dem Stand der Technik bekannten

5 Vergleichsverbindungen.

Die erfindungsgemäßen Vergleichsverbindungen sind in 4-Position des Pyrimidins entweder unsubstituiert (4-H) oder durch einen anderen Substituenten als Amino, z.B. durch Methyl (4-Me) substituiert.

Im Gegensatz dazu weisen die aus WO 2010/076010 A1 vorbekannten Diaminopyrimidine in 4-
10 Position des Pyrimidins eine zusätzliche Aminogruppe auf.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen zeichnen sich durch ein überraschend gutes Wirksamkeitsprofil aus.

Tabelle 3b: Vergleich der herbiziden Wirkung im Nachauflauf von erfindungsgemäßen Verbindungen mit Verbindungen aus WO 2016/001118 A1

Beispiel-Nr. oder Anmeldungs-Nr.	Dosierung [g/ha]	Herbizide Wirkung gegen [%]													
		ALOMY	AVEFA	ECHCG	LORLI	SETVI	ABUTH	AMARE	MATIN	PHBPU	POLCO	STEME	VIOTR	VERPE	HORMU
1.6	320	100					90				100				
	80	90				90	80	100			100				
1.26 aus WO 2016/001118 A1	320		80				70				70				
	80	20				60	50	80			50				
1.7	320								90		100				
	80	80				100									
1.26 aus WO 2016/001118 A1	320										70				
	80	20				60									
1.8	320	70	100	100		100	90	100	100	80	90	100	90		
	320	20	20	40		0	20	80	30	30	0	0	0		

Die in Tabelle 3a (Vorauslauf) und die in Tabelle 3b (Nachlauf) vergleichend gegenübergestellten herbiziden Wirkungen belegen das gute Wirksamkeitsprofil der erfindungsgemäßen Verbindungen 1.6
5 1.7 und 1.8 im Vergleich zu den aus dem Stand der Technik bekannten Vergleichsverbindungen.

Die erfindungsgemäßen Vergleichsverbindungen weisen in 5-Position des Pyrimidins einen Hydroxyalkylrest (5-Hydroxyalkyl) auf.

Im Gegensatz dazu weisen die aus WO 2016/001118 A1 vorbekannten Monoaminopyrimidine in 5-Position des Pyrimidins eine Keto-Gruppe (5-Keto-Pyrimidin) auf.

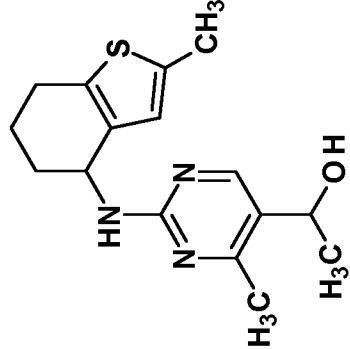
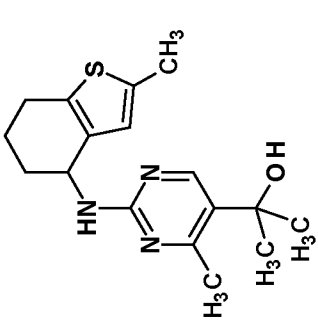
10 Die erfindungsgemäßen Verbindungen zeichnen sich durch ein überraschend gutes Wirksamkeitsprofil aus.

Die Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich, neben einem guten Wirksamkeitsprofil und / oder einer guten Kulturpflanzenverträglichkeit, durch ihre kostengünstige Herstellung aus, da die erfindungsgemäßen Substanzen aus preiswerten und gut zugänglichen Vorstufen durch kostengünstige
15 Prozesse hergestellt werden können. Daher kann auf die Verwendung teurer und schwer zugänglicher Zwischenprodukte verzichtet werden.

Im Folgenden werden, jeweils für die einzelnen Substituenten, bevorzugte, besonders bevorzugte und ganz besonders bevorzugte Bedeutungen beschrieben. Die übrigen Substituenten der allgemeinen Formel (I), welche nachfolgend nicht genannt werden, weisen die oben genannte Bedeutung auf. Das
20 gilt auch für die Laufzahl n, d.h. die Laufzahl n ist in den nachfolgenden Ausführungsformen 0, 1 oder 2.

Tabelle 4a Vergleich der herbiziden Wirkung im Voraufbau von erfindungsgemäßen Verbindungen mit Verbindungen aus WO 2017/016914 A1

Beispiel-Nr. oder Anmeldungs-Nr.	Beispiel-Nr.	Dosierung (g a.l./ha)	Herbizide Wirkung gegen									
			ALOMY	ECHCG	LOLRI	SETVI	ABUTH	PHBPU	POLCO			
erfindungsgemäße Verbindung	1.52	20	90	100	60	100	100	100	100	100	100	100
		20	30	30	0	80	80	0	20			
WO 2017/016914 A1												
erfindungsgemäße Verbindung	1.48	20	70	80	90	100	90	70	100	90	70	100
		20	0	0	0	20	0	0	20			
WO 2017/016914 A1												



Die in Tabelle 4a (Vorauslauf) und die in Tabelle 4b (Nachauflauf) vergleichend gegenübergestellten herbiziden Wirkungen belegen das unerwartet gute Wirksamkeitsprofil der erfindungsgemäßen Verbindungen 1.48 und 1.52 im Vergleich zu den aus WO 2017/016914 A1 bekannten Vergleichsverbindungen.

5

Eine erste Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^{1a} bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff, Cyano;
- 10 - (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann;

R^{1a} besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- 15 - Wasserstoff;
- (C₁-C₃)-Alkyl, (C₁-C₃)-Halogenalkyl, (C₂-C₃)-Alkenyl, (C₂-C₃)-Alkynyl;

R^{1a} ganz besonders bevorzugt Wasserstoff, CH₃, CH₂CH₃, CF₃, C(H)=CH₂ oder C≡CH ist;

R^{1a} am meisten bevorzugt Wasserstoff, CH₃ oder CH₂CH₃ ist.

20 Eine zweite Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^{1b} bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂;
- (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;
- 25 - (C₁-C₆)-Alkoxy carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl;

- (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl;
 - (C₆-C₁₄)-Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - Pyridyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - Thienyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
 - (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können
- 5
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- 10
- Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
 - (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl;
- 15
- R^{1b} besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus
- Cyano;
- 20
- (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Halogenalkyl;
 - (C₁-C₃)-Alkoxy-carbonylmethyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Halogenalkenyl;
 - (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₂-C₄)-Halogenalkynyl;
 - Phenyl, welche am Arylteil mit Halogen und/oder Methyl substituiert sein kann;
 - CH₂Phenyl (Benzyl), welches am Arylteil mit Halogen und/oder Methyl substituiert sein kann;
- 25
- (C₃-C₆)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch Methyl und/oder Halogen substituiert sein kann;

R^{1b} ganz besonders bevorzugt Cyano, CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH(CH₃)₂, CF₃, (C₁-C₂)-Alkoxy-carbonylmethyl, C(H)=CH₂, CH=C(CH₃)₂, (CH₂)₂CH=CH₂, C≡CH, C≡CCH₃, Phenyl, CH₂Phenyl (Benzyl) oder Cyclopropyl ist.

R^{1b} am meisten bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Cyano, CH₃, CH₂CH₃, CF₃,
5 C(H)=CH₂, C≡CH und C≡CCH₃;

Eine dritte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^{1a} mit R^{1b}, im Falle dass R^{1a} ungleich Wasserstoff bedeutet, bevorzugt über eine Bindung miteinander
10 verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff an dem diese beiden Reste gebunden sind ein gesättigter 3 bis 6 gliedriger Carbocyclus entsteht, der unsubstituiert ist oder substituiert ist mit einem oder mehreren Substituenten ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Trifluormethyl, Cyclopropyl;

R^{1a} mit R^{1b}, im Falle dass R^{1a} ungleich Wasserstoff bedeutet, besonders bevorzugt über eine Bindung
15 miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff an dem diese beiden Reste gebunden sind ein gesättigter 3 bis 6 gliedriger Carbocyclus entsteht, der unsubstituiert oder substituiert ist mit einer oder mehreren Methylgruppen, wobei ein unsubstituierter 3 bis 6 gliedriger Carbocyclus, in welchem die Ringelemente jeweils durch CH₂-Einheiten gebildet werden, besonders bevorzugt ist;

R^{1a} mit R^{1b}, im Falle dass R^{1a} ungleich Wasserstoff bedeutet, ganz besonders bevorzugt über eine
20 Bindung miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff an dem diese beiden Reste gebunden sind ein gesättigter 3 gliedriger Carbocyclus entsteht, der unsubstituiert ist oder mit einer Methylgruppe substituiert ist;

R^{1a} mit R^{1b}, im Falle dass R^{1a} ungleich Wasserstoff bedeutet, am meisten bevorzugt über eine Bindung
25 miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff an dem diese beiden Reste gebunden sind ein gesättigter 3 gliedriger Carbocyclus entsteht, der unsubstituiert ist;

Eine vierte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander, bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus
30 Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl und (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-

C₆-haloalkyl, wobei der Cycloalkylrest jeweils unsubstituiert ist oder durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert ist;

5 R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander, besonders bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₃)-Alkoxy, (C₁-C₃)-Alkoxy-(C₁-C₃)-alkyl und (C₃-C₆)-Cycloalkyl;

R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander, ganz besonders bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, CH₃, CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, CF₃, CF₂H, CF₂Cl, CH(CH₃)F, C(CH₃)₂F, Cyclopropyl und CH₂OCH₃;

10 R^{2a} und R^{2b} am meisten bevorzugt jeweils unabhängig voneinander ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, CH₃, CH(CH₃)F und CF₂H; wobei die Kombination

R^{2a} ausgewählt aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, CH₃, CH(CH₃)F und CF₂H und R^{2b} gleich Wasserstoff am allermeisten bevorzugt ist.

15 Eine fünfte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R³ bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff;
- (C₁-C₃)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₃)-Haloalkylcarbonyl;
- Phenylcarbonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, und/oder Methyl substituiert sein können;

20

- (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl;
- (C₂-C₆)-Alkenyl, CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl;
- (C₂-C₆)-Alkynyl, CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl;
- (C₁-C₃)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₃)-alkyl;

25 - Phenyl-(C₁-C₃)-alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen und/oder Methyl substituiert sein können;

- (C₁-C₃)-Alkoxy-(C₁-C₃)-alkyl;

- (C₆-C₁₄)-Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen substituiert sein können;
- (C₁-C₃)-Trialkylsilyl;

R³ besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff;
- 5 - (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl;
- Phenylcarbonyl (Benzoyl)
- (C₁-C₃)-Alkyl;
- CH₂(C₂-C₃)-Alkenyl, CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkenyl;
- CH₂(C₂-C₃)-Alkynyl, CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkynyl,;
- 10 - (C₁-C₃)-Alkoxy-carbonylmethyl;
- CH₂Phenyl (Benzyl);
- CH₂(4-F-Phenyl);
- Si(CH₃)₃;

wobei

- 15 R³ besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus
- Wasserstoff;
- (C₁-C₃)-Alkyl,
- CH₂(C₂-C₃)-Alkenyl,
- CH₂(C₂-C₃)-Alkynyl,
- 20 - CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkenyl,
- CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkynyl,
- (C₁-C₂)-Alkoxy-carbonylmethyl,;

R³ am meisten bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff
- CH₃, CH₂CH₃,
- CH₂CH=CH₂, CH₂C(CH₃)=CH₂, CH₂CH=CHCH₃,
- 5 - CH₂C≡CH, CH₂C≡CCH₃,
- CH(CH₃)CH=CH₂,
- CH(CH₃)C≡CH, und
- CH₂C(O)OCH₃, wobei

R³ in der vorgenannten Gruppe wiederum Wasserstoff oder CH₃ besonders bevorzugt ist, und

10 R³ am allermeisten bevorzugt Wasserstoff ist.

Eine sechste Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

15 R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander, bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Hydroxy, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkylphenyl und (C₁-C₆)-Alkoxy;

R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander, besonders bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl und (C₁-C₆)-Alkoxy;

R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander, ganz besonders bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₃)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy;

20 R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander, am meisten bevorzugt Wasserstoff oder Methyl sind.

In dieser sechsten Ausführungsform ist speziell bevorzugt, wenn mindestens einer der Reste R⁴ bzw. R⁵ Wasserstoff ist. D.h. wenn jeweils mindestens einer der Reste R⁴, bzw. R⁵ Wasserstoff ist und der andere Rest R⁴, bzw. R⁵ ungleich Wasserstoff, nämlich insbesondere (C₁-C₆)-Alkyl, bevorzugt Methyl (CH₃), ist.

Eine siebte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^6 und R^7 unabhängig voneinander, bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C_1-C_6) -Alkyl und (C_6-C_{14}) -Aryl;

5 R^6 und R^7 unabhängig voneinander, besonders bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Methyl und Phenyl;

R^6 und R^7 ganz besonders bevorzugt jeweils Wasserstoff oder Methyl sind;

R^6 und R^7 am meisten bevorzugt Wasserstoff bedeuten.

10 Eine achte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^8 bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, $C(O)OH$, (C_1-C_6) -Alkyl, (C_1-C_6) Alkoxy, (C_1-C_6) -Alkyloxycarbonyl, und (C_6-C_{14}) -Aryl;

15 R^8 besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, $C(O)OH$, (C_1-C_3) -Alkyl, (C_1-C_3) Alkoxy, (C_1-C_3) -Alkyloxycarbonyl und (C_6-C_8) -Aryl;

R^8 ganz besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor, CH_3 , Methoxycarbonyl, und Phenyl;

R^8 am meisten bevorzugt Wasserstoff oder CH_3 ist.

20 Eine neunte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^9 bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, (C_1-C_6) -Alkyl und (C_1-C_6) -Alkoxy;

25 R^9 besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Chlor, Fluor und (C_1-C_3) -Alkoxy;

R^9 ganz besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor und Methoxy;

R⁹ am meisten bevorzugt Wasserstoff ist.

Eine zehnte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

- 5 R¹⁰ bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, Aminocarbonyl, Hydroxycarbonyl, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₂-C₆)-alkinyl, Hydroxy-(C₁-C₆)-Alkyl-(C₂-C₆)-alkinyl, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₂-C₆)-Alkynyl und Aryl-(C₂-C₆)-Alkynyl;
- 10 R¹⁰ besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methoxy (OCH₃), (C₁-C₃)-Alkyl, (C₁-C₃)-Haloalkyl, (C₁-C₃)-Alkoxy, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₁-C₃)-Alkyl-(C₂-C₄)-alkinyl, Hydroxy-(C₁-C₃)-Alkyl-(C₂-C₄)-alkinyl, (C₁-C₃)-Alkoxy-(C₂-C₄)-Alkynyl und Phenyl-(C₂-C₄)-Alkynyl;
- R¹⁰ ganz besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, C≡CH, und C≡CCH₃;
- 15 R¹⁰ am meisten bevorzugt Wasserstoff oder CH₃ ist.

Eine elfte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

- R¹¹ bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und (C₁-C₆)-Alkyl;
- 20 R¹¹ besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und (C₁-C₄)-Alkyl;
- R¹¹ ganz besonders bevorzugt Wasserstoff oder Methyl ist;
- R¹¹ am meisten bevorzugt Wasserstoff ist.

25 Eine zwölfte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

X bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus einer chemischen Bindung, CH₂, O, S,

Carbonyl, NH, CH(C₁-C₆)Alkyl, N(C₁-C₆)Alkyl, OCH₂, und SCH₂ wobei bei den beiden letztgenannten Gruppen das Kohlenstoffatom an den aromatischen Teil und das Heteroatom O oder S an den teilhydrierten Teil des Amins gebunden ist;

5 X besonders bevorzugt ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus einer chemischen Bindung, CH₂, O, S, CHCH₃, NCH₃, OCH₂, und SCH₂ wobei bei den beiden letztgenannten Gruppen das Kohlenstoffatom an den aromatischen Teil und das Heteroatom O oder S an den teilhydrierten Teil des Amins gebunden ist; und in welchen

X am meisten bevorzugt für eine chemische Bindung, CH₂ oder O steht.

10 Im Rahmen der vorliegenden Erfindung ist es möglich, die einzelnen bevorzugten, besonders bevorzugten und ganz besonders bevorzugten Bedeutungen für die Substituenten R^{1a} bis R¹¹ und X beliebig miteinander zu kombinieren, wobei die Laufzahl n 0, 1 oder 2 ist.

Das heißt, dass Verbindungen der allgemeinen Formel (I) von der vorliegenden Erfindung umfasst sind, in welchen beispielsweise der Substituent R^{1a} eine bevorzugte Bedeutung aufweist und die Substituenten 15 R^{1b} bis R¹⁴ die allgemeine Bedeutung aufweisen oder aber der Substituent R^{2a} eine bevorzugte Bedeutung aufweist, der Substituent R³ eine besonders bevorzugte, bzw. eine ganz besonders bevorzugte, Bedeutung aufweist und die übrigen Substituenten eine allgemeine Bedeutung aufweisen.

Drei dieser Kombinationen der oben für die Substituenten R^{1a} bis R¹¹ und X gegebenen Definitionen werden nachfolgend beispielhaft erläutert und jeweils als weitere Ausführungsformen offenbart:

- 20 - Kombination der oben für die Substituenten R¹ bis R¹¹ und X jeweils als besonders bevorzugt bezeichneten Definitionen (dreizehnte Ausführungsform),
- Kombination der oben für die Substituenten R¹ bis R¹¹ und X jeweils als ganz besonders bevorzugt bezeichneten Definitionen (vierzehnte Ausführungsform), und
- 25 - Kombination der oben für die Substituenten R¹ bis R¹¹ und X jeweils als am meisten bevorzugt bezeichneten Definitionen (fünfzehnte Ausführungsform), und

Die vorgenannten auf den bevorzugten Kombinationen der Substituenten basierenden weiteren Ausführungsformen werden nachfolgend aus Gründen der Klarheit explizit offenbart:

Eine dreizehnte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^{1a} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₃)-Alkyl, (C₁-C₃)-Halogenalkyl, (C₂-C₃)-Alkenyl und (C₂-C₃)-Alkynyl;

5 R^{1b} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Halogenalkyl, (C₁-C₃)-Alkoxy-carbonylmethyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Halogenalkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₂-C₄)-Halogenalkynyl, Phenyl, welche am Arylteil mit Halogen und/oder Methyl substituiert sein kann, CH₂Phenyl (Benzyl), welches am Arylteil mit Halogen und/oder Methyl substituiert sein kann und (C₃-C₆)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest
10 durch Methyl und/oder Halogen substituiert sein kann,

wobei, falls R^{1a} ungleich Wasserstoff ist, R^{1a} mit R^{1b} über eine Bindung miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff an dem diese beiden Reste gebunden sind ein gesättigter 3 bis 6 gliedriger Carbocyclus entsteht, der unsubstituiert oder substituiert ist mit einer oder mehreren Methylgruppen, wobei ein unsubstituierter 3
15 bis 6 gliedriger Carbocyclus, in welchem die Ringelemente jeweils durch CH₂-Einheiten gebildet werden, besonders bevorzugt ist;

R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₃)-Alkoxy, (C₁-C₃)-Alkoxy-(C₁-C₃)-alkyl und (C₃-C₆)-Cycloalkyl;

20 R³ ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, Phenylcarbonyl (Benzoyl), (C₁-C₃)-Alkyl, CH₂(C₂-C₃)-Alkenyl, CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkenyl, CH₂(C₂-C₃)-Alkynyl, CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkynyl, (C₁-C₃)-Alkoxy-carbonylmethyl, CH₂Phenyl (Benzyl), CH₂(4-F-Phenyl) und Si(CH₃)₃.

25 R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Hydroxy, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkylphenyl und (C₁-C₆)-Alkoxy;

R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Methyl und Phenyl;

R⁸ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, C(O)OH, (C₁-C₃)-Alkyl, (C₁-C₃)-Alkoxy, (C₁-C₃)-Alkyloxycarbonyl und (C₆-C₈)-Aryl;

30 R⁹ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Chlor, Fluor und (C₁-C₃)-Alkoxy;

R¹⁰ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano,

Methoxy (OCH₃), (C₁-C₃)-Alkyl, (C₁-C₃)-Haloalkyl, (C₁-C₃)-Alkoxy, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₁-C₃)-Alkyl-(C₂-C₄)-alkynyl, Hydroxy-(C₁-C₃)-Alkyl-(C₂-C₄)-alkynyl, (C₁-C₃)-Alkoxy-(C₂-C₄)-Alkynyl und Phenyl-(C₂-C₄)-Alkynyl;

R¹¹ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff und (C₁-C₄)-Alkyl;

5 X für eine chemische Bindung oder O, S, Carbonyl, CH₂, NH, CHCH₃, NCH₃, C(CH₃)₂, OCH₂ und SCH₂ steht, wobei bei den beiden letztgenannten Gruppen das Kohlenstoffatom an den aromatischen Teil und das Heteroatom O oder S an den teilhydrierten Teil des Amins gebunden ist .

10 Eine vierzehnte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^{1a} ausgewählt aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, CH₃, CH₂CH₃, CF₃, C(H)=CH₂ und C≡CH;

15 R^{1b} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Cyano, CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH(CH₃)₂, CF₃, (C₁-C₂)-Alkoxy-carbonylmethyl, C(H)=CH₂, CH=C(CH₃)₂, (CH₂)₂CH=CH₂, C≡CH, C≡CCH₃, Phenyl, CH₂Phenyl (Benzyl) und Cyclopropyl,

wobei, falls R^{1a} ungleich Wasserstoff ist, R^{1a} mit R^{1b} über eine Bindung miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff an dem diese beiden Reste gebunden sind ein gesättigter 3 gliedriger Carbocyclus entsteht, der unsubstituiert ist oder mit einer Methylgruppe substituiert ist;

20

R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander, ganz besonders bevorzugt ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, CH₃, CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, CF₃, CF₂H, CF₂Cl, CH(CH₃)F, C(CH₃)₂F, Cyclopropyl und CH₂OCH₃;

25 R³ ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH=CH₂, CH₂C(CH₃)=CH₂, CH₂CH=CHCH₃, CH₂C≡CH, CH₂C=CCH₃, CH(CH₃)CH=CH₂, CH(CH₃)C≡CH, und CH₂C(O)OCH₃;

R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl und (C₁-C₆)-Alkoxy;

R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander, Wasserstoff oder Methyl sind;

30 R⁸ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor, CH₃, Methoxycarbonyl,

und Phenyl;

R⁹ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor und Methoxy;

R¹⁰ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, C≡CH, und C≡CCH₃;

5 R¹¹ Wasserstoff oder Methyl ist; und

X für eine chemische Bindung steht oder O, S, CH₂, CHCH₃, OCH₂, SCH₂ und NCH₃, steht, wobei bei den beiden letztgenannten Gruppen das Kohlenstoffatom an den aromatischen Teil und das Heteroatom O oder S an den teilhydrierten Teil des Amins gebunden ist.

10 Eine fünfzehnte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung umfasst Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen

R^{1a} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, CH₃ und CH₂CH₃ ;

R^{1b} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Cyano, CH₃, CH₂CH₃, CF₃, C(H)=CH₂, C≡CH und C≡CCH₃ ;

15 wobei, falls R^{1a} ungleich Wasserstoff ist, R^{1a} mit R^{1b} über eine Bindung miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff an dem diese beiden Reste gebunden sind ein gesättigter 3 gliedriger Carbocyclus entsteht, der unsubstituiert ist;

R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, CH₃, CH(CH₃)F und CF₂H;

20 R³ ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff und CH₃;

R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff oder Methyl sind;

R⁶ und R⁷ jeweils Wasserstoff ist;

R⁸ Wasserstoff oder CH₃ ist;

R⁹ Wasserstoff ist;

25 R¹⁰ Wasserstoff oder CH₃ ist;

R¹¹ Wasserstoff ist; und

X für eine chemische Bindung, CH₂ oder O steht.

Im Rahmen der vorliegenden Erfindung sind von der Verbindung der allgemeinen Formel (I) auch Verbindungen umfasst, die durch a) Protonierung, b) Alkylierung oder c) Oxidation an einem Stickstoffatom quaterniert sind. Insbesondere sind diese bezüglich die entsprechenden N-Oxide zu nennen.

Die Verbindungen der Formel (I) können Salze bilden. Salzbildung kann durch Einwirkung einer Base auf solche Verbindungen der Formel (I) erfolgen, die ein acides Wasserstoffatom tragen. Geeignete Basen sind beispielsweise organische Amine, wie Trialkylamine, Morpholin, Piperidin oder Pyridin sowie Ammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide, -carbonate und -hydrogencarbonate, insbesondere Natrium- und Kaliumhydroxid, Natrium- und Kaliumcarbonat und Natrium- und Kaliumhydrogencarbonat. Diese Salze sind Verbindungen, in denen der acide Wasserstoff durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird, beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalimetallsalze oder Erdalkalimetallsalze, insbesondere Natrium- und Kaliumsalze, oder auch Ammoniumsalze, Salze mit organischen Aminen oder quartäre (quaternäre) Ammoniumsalze, zum Beispiel mit Kationen der Formel $[NRR'R''R''']^+$, worin R bis R''' jeweils unabhängig voneinander einen organischen Rest, insbesondere Alkyl, Aryl, Alkyl oder Alkylaryl darstellen. Infrage kommen auch Alkylsulfonium- und Alkylsulfoxoniumsalze, wie (C₁-C₄)-Trialkylsulfonium- und (C₁-C₄)-Trialkylsulfoxoniumsalze.

Die Verbindungen der Formel (I) können durch Anlagerung einer geeigneten anorganischen oder organischen Säure, wie beispielsweise Mineralsäuren, wie beispielsweise HCl, HBr, H₂SO₄, H₃PO₄ oder HNO₃, oder organische Säuren, z. B. Carbonsäuren, wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Oxalsäure, Milchsäure oder Salicylsäure oder Sulfonsäuren, wie zum Beispiel p-Toluolsulfonsäure, an eine basische Gruppe, wie z.B. Amino, Alkylamino, Dialkylamino, Piperidino, Morpholino oder Pyridino, Salze bilden. Diese Salze enthalten dann die konjugierte Base der Säure als Anion.

Geeignete Substituenten, die in deprotonierter Form, wie z.B. Sulfonsäuren oder Carbonsäuren, vorliegen, können innere Salze mit ihrerseits protonierbaren Gruppen, wie Aminogruppen bilden.

Im Folgenden werden die Verbindungen der Formel (I) und ihre Salze auch kurz als erfindungsgemäß verwendete oder erfindungsgemäße "Verbindungen (I)" bezeichnet.

In der allgemeinen Formel (I) und allen übrigen Formeln in der vorliegenden Erfindung können die Reste Alkyl, Alkoxy, Haloalkyl, Haloalkoxy, Alkylamino, Alkylthio, Haloalkylthio, sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Wenn nicht speziell angegeben, sind bei diesen Resten die niederen

Kohlenstoffgerüste, z. B. mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, insbesondere 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, bevorzugt. Alkylreste, auch in den zusammengesetzten Bedeutungen wie Alkoxy, Haloalkyl usw., bedeuten z.B. Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, t- oder 2-Butyl, Pentyle, Hexyle, wie n-Hexyl, i-Hexyl und 1,3-Dimethylbutyl, Heptyle, wie n-Heptyl, 1-Methylhexyl und 1,4-Dimethylpentyl; Alkenyl- und Alkynylreste haben die Bedeutung der den Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten Reste; wobei mindestens eine Doppelbindung bzw. Dreifachbindung, vorzugsweise eine Doppelbindung bzw. Dreifachbindung enthalten ist. Alkenyl bedeutet z.B. Vinyl, Allyl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, But-2-en-1-yl, But-3-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl und 1-Methyl-but-2-en-1-yl; Alkynyl bedeutet z.B. Ethinyl, Propargyl, But-2-in-1-yl, But-3-in-1-yl und 1-Methyl-but-3-in-1-yl.

Cycloalkyl-Gruppen sind z. B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl. Die Cycloalkyl Gruppen können in bi- oder tri-cyclischer Form vorkommen.

Wenn Haloalkylgruppen und Haloalkylreste von Haloalkoxy, Haloalkylthio, Haloalkenyl, Haloalkinyl u.a. angegeben sind, sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z. B. mit 1 bis 6 C-Atomen oder 2 bis 6, insbesondere 1 bis 4 C-Atomen oder bevorzugt 2 bis 4 C-Atomen, sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt. Beispiele sind Difluormethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Trifluorallyl, 1-Chlorprop-1-yl-3-yl.

Alkylen-Gruppen sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z. B. mit 1 bis 10 C-Atomen, insbesondere 1 bis 6 C-Atomen oder bevorzugt 2 bis 4 C-Atomen, sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst, die jeweils geradkettig oder verzweigt sein können. Beispiele sind Methylen, Ethylen, n- und i- Propylen und n-, s-, i-, t-Butylen.

Hydroxyalkylgruppen sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z. B. mit 1 bis 6 C-Atomen, insbesondere 1 bis 4 C-Atomen, sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Resten im Kohlenstoffgerüst, die jeweils geradkettig oder verzweigt sein können. Beispiele hierzu sind 1,2-Dihydroxyethyl und 3-Hydroxypropyl.

Halogen bedeutet Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Haloalkyl, -alkenyl und -alkinyl bedeuten durch Halogen, vorzugsweise durch Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere durch Fluor und/oder Chlor, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, Alkenyl bzw. Alkynyl, z.B. Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl), Perhaloalkyl, CF₃, CF₂Cl, CHF₂, CH₂F, CF₃CF₂, CH₂FCHCl, CCl₃, CHCl₂, CH₂CH₂Cl; Haloalkoxy ist z.B. OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ und OCH₂CH₂Cl; entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierte Reste.

Aryl bedeutet ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, beispielsweise Phenyl oder Naphthyl, vorzugsweise Phenyl.

auch mit (R)-Konfiguration erfasst, d.h., dass die vorliegende Erfindung die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erfasst, in welchen das betreffende Kohlenstoffatom

(1) eine (R)-Konfiguration; oder

(2) eine (S)-Konfiguration

5 aufweist.

Darüber hinaus werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung auch

(3) beliebige Mischungen von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), welche eine (R)-Konfiguration (Verbindungen der allgemeinen Formel (I-(R))) aufweisen, mit Verbindungen der allgemeinen Formel (I), welche eine (S)-Konfiguration (Verbindungen der allgemeinen Formel (I-S))

10 aufweisen, erfasst, wobei eine racemische Mischung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) mit (R)- und (S)-Konfiguration von der vorliegenden Erfindung ebenfalls umfasst ist.

Allerdings sind im Rahmen der vorliegenden Erfindung insbesondere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) mit (R)-Konfiguration mit einer Selektivität von 60 bis 100%, vorzugsweise 80 bis 100%, insbesondere 90 bis 100%, ganz besonders 95 bis 100%, bevorzugt, wobei die jeweilige (R)-Verbindung

15 mit einer Enantioselektivität von jeweils mehr als 50% ee, vorzugsweise 60 bis 100% ee, insbesondere 80 bis 100% ee, ganz besonders 90 bis 100% ee, meist bevorzugt 95 bis 100% ee, bezogen auf den Gesamtgehalt an betreffender (R)-Verbindung vorliegt.

Daher betrifft die vorliegende Erfindung insbesondere Verbindungen der allgemeinen Formel (I*), in welchen die stereochemische Konfiguration an dem mit (*) gekennzeichneten Kohlenstoffatom mit einer

20 stereochemischen Reinheit von 60 bis 100 % (R), vorzugsweise 80 bis 100 % (R), insbesondere 90 bis 100 % (R), ganz besonders 95 bis 100 % (R), vorliegt.

Unter Berücksichtigung der Regel nach Cahn, Ingold und Prelog kann es an dem mit (*) gekennzeichneten Kohlenstoffatom auch zu einer Situation kommen, in welcher aufgrund der Priorität der jeweiligen Substituenten die (S)-Konfiguration am mit (*) gekennzeichneten Kohlenstoffatom

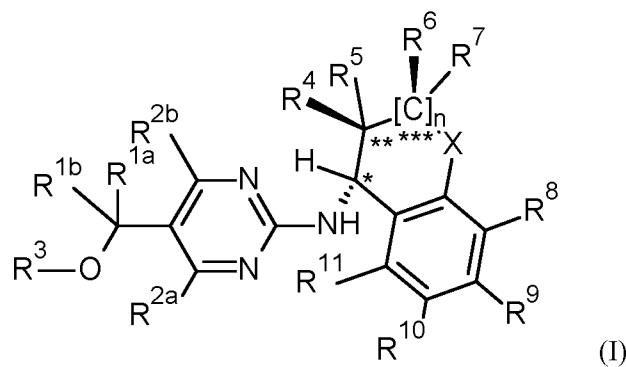
25 bevorzugt ist. Dieses ist beispielweise dann der Fall, wenn die Reste R⁴ und/oder R⁵ einem C₁-C₆-Alkoxyrest entsprechen.

Daher sind im Rahmen der vorliegenden Erfindung insbesondere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bevorzugt, die in ihrer räumlichen Anordnung denjenigen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) mit R⁴ und R⁵ = Wasserstoff mit (R)-Konfiguration entsprechen, mit einer Selektivität von 60 bis 100 %, vorzugsweise 80 bis 100 %, insbesondere 90 bis 100 %, ganz besonders 95 bis 100 %, bevorzugt, wobei

30 die jeweilige (R)-analoge-Verbindung mit einer Enantioselektivität von jeweils mehr als 50 % ee,

vorzugsweise 60 bis 100 % ee, insbesondere 80 bis 100 % ee, ganz besonders 90 bis 100 % ee, meist bevorzugt 95 bis 100 % ee, bezogen auf den Gesamtgehalt an betreffender (R)-analogen-Verbindung, vorliegt. Daher betrifft die vorliegende Erfindung insbesondere Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in welchen die stereochemische Konfiguration an dem mit (*) gekennzeichneten Kohlenstoffatom mit einer stereochemischen Reinheit von 60 bis 100 % (R, bzw. analog-R), vorzugsweise 80 bis 100 % (R, bzw. analog-R), insbesondere 90 bis 100 % (R, bzw. analog-R), ganz besonders 95 bis 100 % (R, bzw. analog-R), vorliegt.

Insbesondere können die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) noch weitere Chiralitätszentren an den mit (**) und (***) gekennzeichneten Kohlenstoffatomen aufweisen:



10

Im Rahmen der vorliegenden Erfindung sind beliebige stereochemische Konfigurationen an den mit (*), (***) und (***) gekennzeichneten Kohlenstoffatomen möglich:

Konfiguration Kohlenstoffatom (*)	Konfiguration Kohlenstoffatom (**)	Konfiguration Kohlenstoffatom (***)
R	R	R
R	R	S
R	S	R
S	R	R
R	S	S
S	R	S
S	S	R
S	S	S

Darüber hinaus können, je nach Wahl der jeweiligen Reste, weitere Stereoelemente in den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorliegen.

Sind beispielsweise eine oder mehrere Alkenylgruppen vorhanden, so können Diastereomere (Z- und E-

15

Isomere) auftreten.

Sind beispielsweise ein oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome vorhanden, so können Enantiomere und Diastereomere auftreten.

5 Entsprechende Stereoisomere lassen sich aus den bei der Herstellung anfallenden Gemischen nach üblichen Trennmethoden, beispielsweise durch chromatographische Trennverfahren, erhalten. Ebenso können Stereoisomere durch Einsatz stereoselektiver Reaktionen unter Verwendung optisch aktiver Ausgangs- und/oder Hilfsstoffe selektiv hergestellt werden. Die Erfindung betrifft somit auch alle Stereoisomeren, die von der allgemeinen Formel (I) umfaßt werden, jedoch nicht mit ihrer spezifischen Stereoform angegeben sind und deren Gemische.

10 Die Kombinationsmöglichkeiten der verschiedenen Substituenten der allgemeinen Formel (I) sind so zu verstehen, dass die allgemeinen Grundsätze des Aufbaus chemischer Verbindungen zu beachten sind, d.h. die Formel (I) nicht Verbindungen umfasst, von denen der Fachmann weiß, dass sie chemisch nicht möglich sind.

15 Im Folgenden werden in tabellarischer Form Beispiele der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wiedergegeben.

In der nachfolgenden Tabelle 1 werden die in Formel (I) allgemein definierten Substituenten spezifiziert. Dabei steht :

- „StNH“ für stereochemische Anordnung am Kohlenstoffatom, an das das Stickstoffatom und das Wasserstoffatom gebunden sind, „StR⁴R⁵“ und „StR⁶R⁷“ steht analog für die Kohlenstoffatome an die die jeweiligen Substituenten gebunden sind,
- die Bindung der Substituenten ist jeweils links,
- sofern für X zwei Bindestellen angegeben sind, bindet die linke Bindung an den Aromaten und die rechte Bindung an den hydrierten Teil des bicyclischen Amins,
- ein Bindestrich „-“ für eine direkte Bindung, und
- 25 - falls n=0 ist, enthält die Tabelle in dem entsprechenden Feld für R⁶ und R⁷ keinen Eintrag.

Tabelle 5:

Nr.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	StNH	R ⁴	R ⁵	StR ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.1	H	CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2	H	H	H	H	-
1.2	H	CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.3	H	CH ₃	H	H	CH ₂ (4-F-Ph)	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.4	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.5	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.6	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.7	H	CH ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.8	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	H	H	H	H	-
1.9	CH ₃	CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1	H	H	H	H	O
1.10	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.11	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.12	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.13	H	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.14	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.15	CH ₃	C(H)=CH ₂	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.16	CH ₃	CN	H	H	Si(CH ₃) ₃	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.17	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.18	CH ₃	C≡CH	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.19	H	CH ₃	CH(CH ₃)F	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.20	CH ₃	Cyclopropyl	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.21	CH ₃	Ph	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-

Nr.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	StNH	R ⁴	R ⁵	StR ⁴	R ⁶	R ⁷	n	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.22	CH ₃	C≡CCH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.23	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)F	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.24	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₃	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.25	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.26	CH ₃	CH ₂ Ph	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.27	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.28	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.29	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	H	H	-
1.30	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	H	H	-
1.31	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.32	CH ₃	CH ₃	H	H	H	S	OH	H	S	H	H	1	H	H	H	H	-
1.33	CH ₃	CH ₃	H	H	H	S	OCH ₃	H	S	H	H	1	H	H	H	H	-
1.34	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	OCH ₃	H	H	H	-
1.35	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	H	H	CH ₃	H	-
1.36	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	2	H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.37	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	H	F	H	H	-
1.38	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₃	H	O
1.39	CH ₃	CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1	H	H	F	H	O
1.40	CH ₃	CH ₃	H	H	H	rac	H	H				0	H	H	H	H	O
1.41	CH ₃	CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2	CH ₃	H	H	H	-
1.42	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	CH ₃	H	H	H	-
1.43	CH ₃	CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2	H	H	CH ₃	H	-

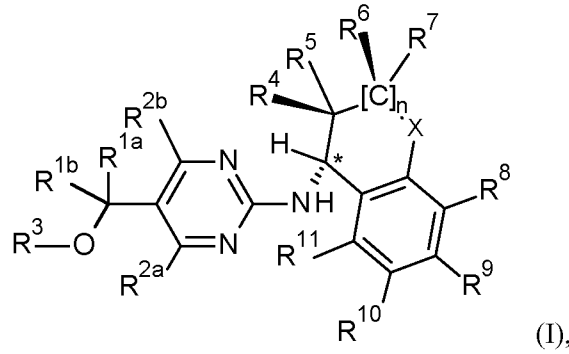
Nr.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	StNH	R ⁴	R ⁵	StR ⁴	R ⁶	R ⁷	n	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.44	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2	OCH ₃	H	H	H	-
1.45	H	CH ₃	CH ₃	H	H	S	OH	H	S	H	H	1	H	H	H	H	-
1.46	H	CH ₃	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2	OCH ₃	H	H	H	-
1.47	H	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	H	H	-
1.48	H	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	H	H	CH ₃	H	-
1.49	H	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₃	H	O
1.50	H	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.51	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	rac	H	H	1	H	H	H	H	-
1.52	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2	H	H	CH ₃	H	-
1.53	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₃	H	O
1.54	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	H	H	-
1.55	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	rac	H	H	1	H	H	H	H	-
1.56	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	S	OH	H	S	H	H	1	H	H	H	H	-
1.57	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.58	CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.59	CH ₃	CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2	OCH ₃	H	H	H	-
1.60	H	CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2	CH ₃	H	H	H	-
1.61	CH ₃	1-Methylcyclopropyl	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.62	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₃	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.63	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.64	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.65	CH ₃	CH ₂ C(O)OCH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-

Nr.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	StNH	R ⁴	R ⁵	StR ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.66	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ C(O)OCH ₃	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.67	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	H	H	-
1.68	CH ₃	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2	OCH ₃	H	H	H	-
1.69	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	H	H	H	H	-
1.70	CH ₃	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2	CH ₃	H	H	H	-
1.71	CH ₃	CF ₃	H	H	H	S	OCH ₃	H	rac	H	H	1	H	H	H	H	-
1.72	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ C≡CH	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.73	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.74	CF ₃	C≡CCH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.75	CF ₃	C≡CH	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.76	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ Cyclopropyl	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.77	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ Phenyl	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.78	H	CF ₃	H	H	CH ₃	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.79	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.80	H	CF ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.81	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2	OCH ₃	H	H	H	-
1.82	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	C(O)OCH ₃	H	H	H	-
1.83	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	C(O)OCH ₃	H	H	H	-
1.84	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	C(O)OCH ₃	H	H	H	-
1.85	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ CH=CH(CH ₃)	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.86	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ C≡CCH ₃	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.87	CH ₃	CH ₃	H	H	CH(CH ₃)C≡CH	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-

Nr.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	StNH	R ⁴	R ⁵	StR ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.88	H	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.89	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.90	H	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.91	H	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH(CH ₃)	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.92	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	H	H	CH ₃	H	-
1.93	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2	CH ₃	H	H	H	-
1.94	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	CH ₃	H	H	H	-
1.95	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	H	H	H	H	-
1.96	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1	H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.97	CH ₃	CH ₂ C(O)OCH ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.98	H	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH=CH ₂	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.99	CH ₃	CH ₃	H	H	CH(CH ₃)CH=CH ₂	R	CH ₃	H	S	H	H	1	H	H	CH ₃	H	-
1.100	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	CH ₃	H	H	H	-
1.101	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	F	H	H	H	-
1.102	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	F	H	H	H	-
1.103	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	F	H	H	H	-
1.104	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	F	H	H	H	-
1.105	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	Cl	H	H	H	-
1.106	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	Cl	H	H	H	-
1.107	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	Cl	H	H	H	-
1.108	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	Cl	H	H	H	-
1.109	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	CH ₃	H	CH ₃	H	-

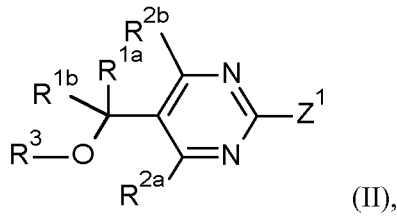
Nr.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	StNH	R ⁴	R ⁵	StR ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.110	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	CH ₃	H	CH ₃	H	-
1.111	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	CH ₃	H	CH ₃	H	-
1.112	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	CH ₃	H	CH ₃	H	-
1.113	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	F	H	CH ₃	H	-
1.114	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	F	H	CH ₃	H	-
1.115	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	F	H	CH ₃	H	-
1.116	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	F	H	CH ₃	H	-
1.117	CH ₃	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	Cl	H	CH ₃	H	-
1.118	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	Cl	H	CH ₃	H	-
1.119	CH ₃	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2	Cl	H	CH ₃	H	-
1.120	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2	Cl	H	CH ₃	H	-

Weiterer Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verfahren zur Herstellung entsprechender Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren Salze und/oder deren agrochemisch verträglichen quaternierten Stickstoff-Derivate



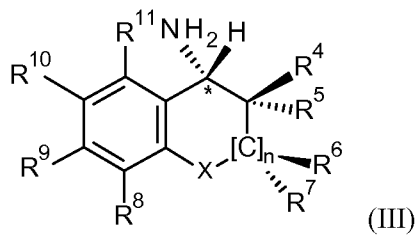
in welchen die Reste R^{1a} bis R¹¹ sowie X und n die vorstehenden Bedeutungen aufweisen, und wobei nach einem ersten Verfahren (Verfahren (a))

a) eine Verbindung der allgemeinen Formel (II)



10 wobei R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b} und R³ die vorstehende Bedeutung aufweisen und Z¹ für einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe steht,

mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz desamins der allgemeinen Formel (III)



15 umgesetzt wird,

wobei die Reste R⁴ bis R¹¹, X und n die vorstehende Bedeutung aufweisen.

Der austauschfähige Rest Z^1 , bzw. die Abgangsgruppe Z^1 steht für Fluor, Chlor, Brom, Jod, ein (C₁-C₄)-Alkylsulfanyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, ein unsubstituiertes oder ein einfach oder mehrfach mit Fluor, Chlor, Brom oder (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkylsulfonyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylphenyl-sulfonyl.

- 5 Besonders bevorzugte austauschfähige Reste Z^1 , bzw. Abgangsgruppen Z^1 , sind Chlor, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.

Gegebenenfalls kann ein Rest Z^1 in eine andere, besser austauschbare Gruppe überführt werden. So kann beispielsweise im Sinne eines Zweistufen-Eintopfverfahren ein (C₁-C₄)-Alkylsulfanyl mit einem Oxidationsmittel wie m-Chlorperbenzoesäure oder Oxone[®] in ein (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl oder Mischungen davon überführt werden und anschließend mit einem Amin der
10 allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz unter Verwendung einer Hilfsbase wie z.B. Triethylamin oder Kaliumcarbonat zur Reaktion gebracht werden.

Gegebenenfalls kann die Umsetzung auch durch unterschiedliche Hilfsstoffe katalysiert werden, wie beispielsweise durch die Reagenzien Kaliumphosphat, Kupfer(I)iodid und N,N-diethyl-2-
15 hydroxybenzamide oder im Sinne der Buchwald-Hartwig-Kupplung durch spezielle Übergangsmetallkatalysatorsysteme.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (II) können nach bekannten Verfahren beispielsweise aus den entsprechenden 5-Keto-Pyrimidinen hergestellt werden. So können 5-Keto-Pyrimidine der unten beschriebenen allgemeinen Formel (IIa), vom Typ [5-C(=O)-R^{1b}], beispielsweise durch aus der Literatur
20 bekannte reduktive Verfahren zu Verbindungen der Formel (I), in denen R^{1a} und R³ Wasserstoff bedeutet, umgesetzt werden. Bevorzugt ist die Reduktion mittels Natriumtetrahydroborat. Darüber hinaus können Aldehyde oder Ketone der unten beschriebenen allgemeinen Formel (IIb), vom Typ [5-C(=O)-R^{1a}], beispielsweise durch Reaktionen mit Kohlenstoff-Nucleophilen zu Verbindungen der Formel (I) umgesetzt werden. Derartige Reaktionen von C-Nucleophilen an die C-O-Doppelbindung,
25 wie beispielsweise die Aldoladdition, die Grignard-Reaktion oder die Reformatzki-Reaktion, sind dem Fachmann gut aus der Literatur bekannt.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (II) können beispielsweise auch aus den entsprechenden 5-Halogenpyrimidinen, besonders bevorzugt aus den entsprechenden 5-Brompyrimidinen oder 5-Iodpyrimidinen, nach bekannten Verfahren hergestellt werden. So können die entsprechenden 5-
30 Halogenpyrimidine beispielsweise mit Ketonen der Formel R^{1a}C(O)R^{1b} und einer Lithiumorganischen Verbindung, wie beispielsweise n-Butyllithium, in Verbindungen der allgemeinen Formel (II), in welchen R³ für Wasserstoff steht, übergeführt werden.

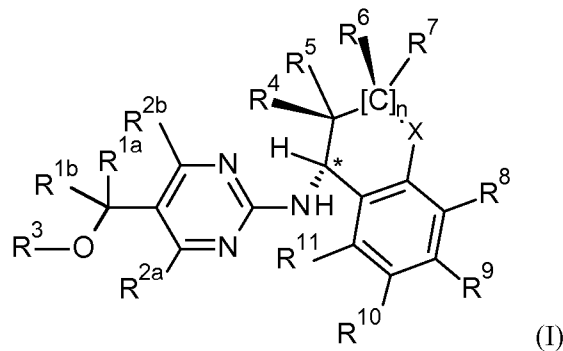
In dem Fall, dass R³ für Wasserstoff steht, kann das Wasserstoff-Atom beispielsweise durch Reaktionen

vom Typ einer Alkylierung oder einer Acylierung in andere Moleküle der Formel (II) übergeführt werden.

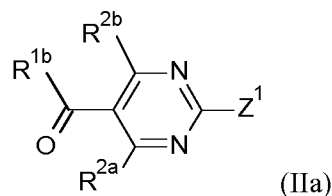
In dem Fall, dass R^3 für Wasserstoff steht kann auch erst nach Umsetzung mit dem Amin der allgemeinen Formel (III) das Wasserstoff-Atom durch Reaktionen vom Typ einer Alkylierung oder einer
5 Acylierung in andere Moleküle der Formel (I) übergeführt werden.

Die Amine der allgemeinen Formel (III) oder die Säureadditionssalze davon sind kommerziell verfügbar oder deren Synthese ist in WO 2004/069814 A1 beschrieben.

In einer weiteren Ausführungsform werden die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren agrochemisch verträgliche Salze und/oder deren agrochemisch verträgliche quaternierte
10 Stickstoff-Derivate



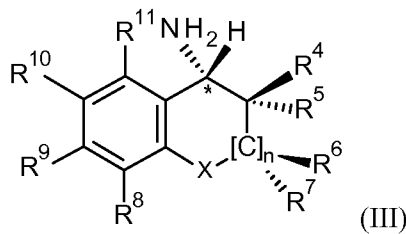
in welchen die Reste R^{1a} bis R^{11} sowie X und n die vorstehenden Bedeutungen aufweisen, nach einem zweiten Verfahren (b) hergestellt werden, in welchem zunächst
eine Verbindung der allgemeinen Formel (IIa)



15

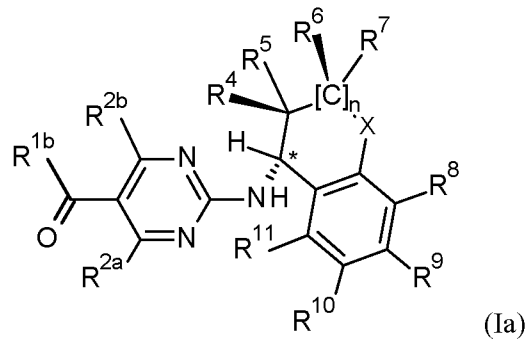
worin R^{1b} und R^{2a} sowie R^{2b} die vorstehende Bedeutung aufweisen und Z^1 für einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe steht,

mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz desamins der allgemeinen Formel (III)



wobei die Reste R^4 bis R^{11} , X und n die vorstehende Bedeutung aufweisen,

zu 2-Amino-5-Keto-Pyrimidinderivaten der Formel (Ia)



5 umgesetzt wird,

wobei die Reste R^{1b} bis R^{11} sowie X und n die vorstehenden Bedeutungen aufweisen.

Der austauschfähige Rest Z^1 , bzw. die Abgangsgruppe Z^1 steht für Fluor, Chlor, Brom, Jod, ein (C₁-C₄)-Alkylsulfanyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, ein unsubstituiertes oder ein substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkylsulfonyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylphenyl-sulfonyl.

10 Besonders bevorzugte austauschfähige Reste Z^1 , bzw. Abgangsgruppen Z^1 , sind Chlor, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.

Gegebenenfalls kann ein Rest Z^1 in eine andere, besser austauschbare Gruppe überführt werden. So kann beispielsweise im Sinne eines Zweistufen-Eintopfverfahren ein (C₁-C₄)-Alkylsulfanyl mit einem Oxidationsmittel wie m-Chlorperbenzoesäure oder Oxone[®] in ein (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl oder ein (C₁-
 15 C₄)-Alkylsulfonyl oder Mischungen davon überführt werden und anschließend mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz unter Verwendung einer Hilfsbase wie z.B. Triethylamin oder Kaliumcarbonat zur Reaktion gebracht werden.

Gegebenenfalls kann die Umsetzung auch durch unterschiedliche Hilfsstoffe katalysiert werden, wie beispielsweise durch die Reagenzien Kaliumphosphat, Kupfer(I)iodid und N,N-diethyl-2-
 20 hydroxybenzamide oder im Sinne der Buchwald-Hartwig-Kupplung durch spezielle Übergangsmetallkatalysatorsysteme.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (IIa) sind kommerziell verfügbar oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden, zum Beispiel nach Verfahren, die in Dokument WO 2016/001118 A1 beschrieben sind.

Die Amine der allgemeinen Formel (III) oder die Säureadditionssalz davon sind kommerziell verfügbar oder deren Synthese ist in WO 2004/069814 A1 beschrieben.

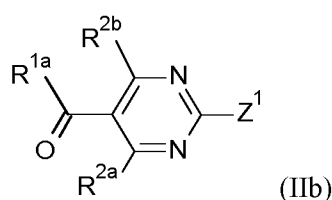
Die so hergestellten 2-Amino-5-Keto-Pyrimidinderivate der Formel (Ia), werden anschließend durch aus der Literatur bekannte reduktive Verfahren zu Verbindungen der Formel (I) umgesetzt, in denen R^{1a} und R^3 Wasserstoff bedeutet. Bevorzugt ist die Reduktion mittels Natriumtetrahydroborat.

Darüber hinaus können die so hergestellten 2-Amino-5-Keto-Pyrimidinderivate der Formel (Ia) mit Kohlenstoff-Nucleophilen [vom Typ $(R^{1a})^-$] zu Verbindungen der Formel (I), in welchen R^3 für Wasserstoff steht, umgesetzt werden. Derartige zur Einführung des Restes R^{1a} geeignete Reaktionen, wie beispielsweise die Aldoladdition, die Grignard-Reaktion (mit $R^{1a}MgHal$) oder die Reformatzki-Reaktion, sind dem Fachmann aus der Literatur bekannt.

In den so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in denen R^3 für Wasserstoff steht, kann das Wasserstoff-Atom ($R^3=H$) beispielsweise durch Reaktionen vom Typ einer Alkylierung oder einer Acylierung in andere Moleküle der Formel (I), mit R^3 ungleich Wasserstoff, übergeführt werden.

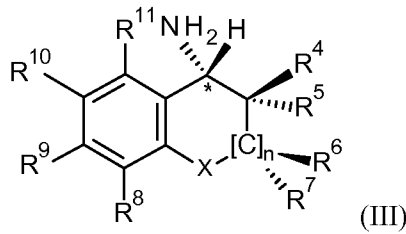
Analog den unter b. beschriebenen Verfahren können alternativ auch Aldehyde oder Ketone der allgemeinen Formel (IIb) als Edukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) eingesetzt werden.

Dabei werden Aldehyde oder Ketone der allgemeinen Formel (IIb)



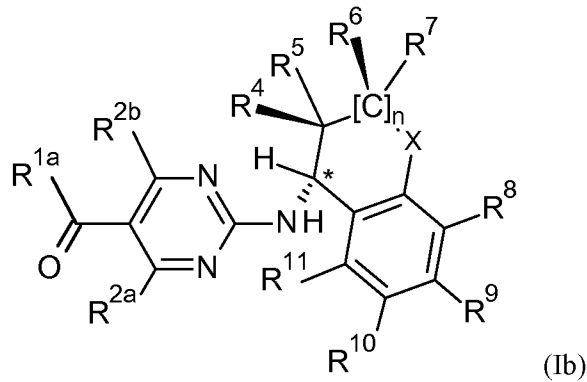
worin R^{1a} und R^{2a} sowie R^{2b} die vorstehende Bedeutung aufweisen und Z^1 für einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe steht,

mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz desamins der allgemeinen Formel (III)



wobei die Reste R^4 bis R^{11} , X und n die vorstehende Bedeutung aufweisen,

zu 2-Amino-5-Keto-Pyrimidinderivaten der Formel (Ib)



5 umgesetzt wird, wobei die Reste R^{1a} bis R^{11} sowie X und n die vorstehenden Bedeutungen aufweisen.

Der austauschfähige Rest Z^1 , bzw. die Abgangsgruppe Z^1 steht für Fluor, Chlor, Brom, Jod, ein (C₁-C₄)-Alkylsulfanyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, ein unsubstituiertes oder ein substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkylsulfonyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylphenyl-sulfonyl.

10 Besonders bevorzugte austauschfähige Reste Z^1 , bzw. Abgangsgruppen Z^1 , sind Chlor, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.

Gegebenenfalls kann ein Rest Z^1 in eine andere, besser austauschbare Gruppe überführt werden. So kann beispielsweise im Sinne eines Zweistufen-Eintopfverfahren ein (C₁-C₄)-Alkylsulfanyl mit einem Oxidationsmittel wie m-Chlorperbenzoesäure oder Oxone[®] in ein (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl oder Mischungen davon überführt werden und anschließend mit einem Amin der
 15 allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz unter Verwendung einer Hilfsbase wie z.B. Triethylamin oder Kaliumcarbonat zur Reaktion gebracht werden.

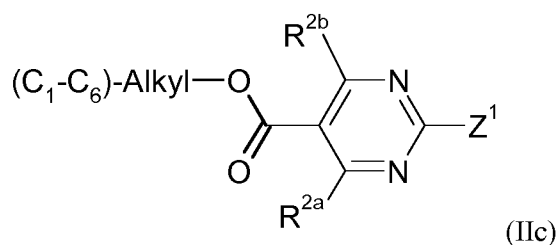
Gegebenenfalls kann die Umsetzung auch durch unterschiedliche Hilfsstoffe katalysiert werden, wie beispielsweise durch die Reagenzien Kaliumphosphat, Kupfer(I)iodid und N,N-diethyl-2-
 20 hydroxybenzamide oder im Sinne der Buchwald-Hartwig-Kupplung durch spezielle

Übergangsmetallkatalysatorsysteme.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (IIb) sind kommerziell verfügbar oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden, zum Beispiel nach Verfahren, die in Dokument WO 2016/001118 A1 beschrieben sind.

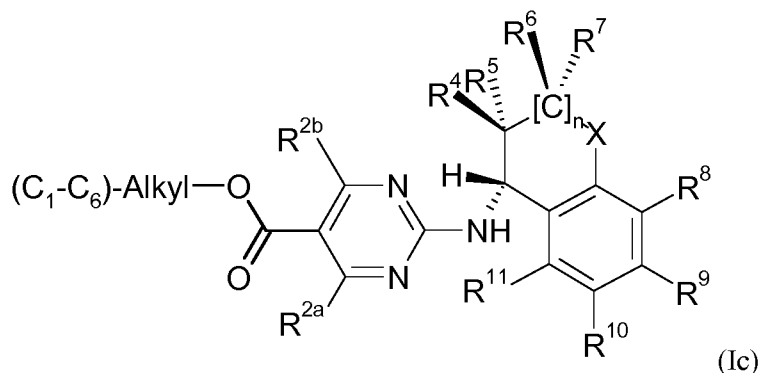
- 5 Die so hergestellten 2-Amino-5-Keto-Pyrimidinderivate der Formel (Ib), können anschließend durch in der Literatur bekannte Reaktionen mit Kohlenstoff-Nucleophilen [vom Typ $(R^{1b})^-$] zu Verbindungen der Formel (I), in welchen R^3 für Wasserstoff steht, umgesetzt werden. Derartige Reaktionen, wie beispielsweise die Aldoladdition, die Grignard-Reaktion (mit $R^{1b}MgHal$) oder die Reformatzki-Reaktion, sind dem Fachmann gut aus der Literatur bekannt.
- 10 In den so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in denen R^3 für Wasserstoff steht, kann das Wasserstoff-Atom ($=R^3$) beispielsweise durch Reaktionen vom Typ einer Alkylierung oder einer Acylierung in andere Moleküle der Formel (I), mit R^3 ungleich Wasserstoff, übergeführt werden.

- Alternativ können Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem dritten Verfahren (c) auch
 15 dadurch hergestellt werden, dass zunächst eine Verbindung der allgemeinen Formel (IIc)



worin R^{2a} und R^{2b} die vorstehende Bedeutung aufweisen und Z^1 für einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe steht,

- analog den unter a. beschriebenen Verfahren, mit einem Amin der Formel (III) oder einem
 20 Säureadditionssalz einesamins der Formel (III) in ein Intermediat der Formel (Ic)



übergeführt wird,

wobei die Reste R^{2a} bis R^{11} sowie X und n die vorstehenden Bedeutungen aufweisen.

Die so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (Ic), in denen (C₁-C₆)-Alkyl besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl bedeutet, können anschließend nach in der Literatur beschriebene Verfahren, besonders bevorzugt durch Grignard-Reaktion, in Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in denen R^{1a} und R^{1b} dieselbe Bedeutung haben, übergeführt werden. Somit stellt die Variante (c) eine zusätzliche Option dar, um Verbindungen der Formel (I) zu erhalten, in denen z.B. $R^{1a} = \text{CH}_3$ und $R^{1b} = \text{CH}_3$ bedeutet.

Kollektionen aus Verbindungen der Formel (I) und/oder deren Salzen, die nach den oben genannten Reaktionen synthetisiert werden können, können auch in parallelisierter Weise hergestellt werden, wobei dies in manueller, teilweise automatisierter oder vollständig automatisierter Weise geschehen kann. Dabei ist es beispielsweise möglich, die Reaktionsdurchführung, die Aufarbeitung oder die Reinigung der Produkte bzw. Zwischenstufen zu automatisieren. Insgesamt wird hierunter eine Vorgehensweise verstanden, wie sie beispielsweise durch D. Tiebes in *Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening* (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley 1999, auf den Seiten 1 bis 34 beschrieben ist.

Zur parallelisierten Reaktionsdurchführung und Aufarbeitung können eine Reihe von im Handel erhältlichen Geräten verwendet werden, beispielsweise Reaktionsstationen (reaction stations) der Firma Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, England oder MultiPROBE Automated Workstations der Firma Perkin Elmer, Waltham, Massachusetts 02451, USA. Für die parallelisierte Aufreinigung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Salzen beziehungsweise von bei der Herstellung anfallenden Zwischenprodukten stehen unter anderem Chromatographieapparaturen zur Verfügung, beispielsweise der Firma Teledyne ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Die aufgeführten Apparaturen führen zu einer modularen Vorgehensweise, bei der die einzelnen Arbeitsschritte automatisiert sind, zwischen den Arbeitsschritten jedoch manuelle Operationen durchgeführt werden müssen. Dies kann durch den Einsatz von teilweise oder vollständig integrierten Automationssystemen umgangen werden, bei denen die jeweiligen Automationsmodule beispielsweise durch Roboter bedient werden.

Die Durchführung einzelner oder mehrerer Syntheseschritte kann durch den Einsatz von Polymer-supported reagents/Scavenger-Harze unterstützt werden. In der Fachliteratur sind eine Reihe von Versuchsprotokollen beschrieben, beispielsweise in ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

Neben den hier beschriebenen Methoden kann die Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Salzen vollständig oder partiell durch Festphasen unterstützte Methoden erfolgen. Zu diesem Zweck werden einzelne Zwischenstufen oder alle Zwischenstufen der Synthese oder einer für die entsprechende Vorgehensweise angepassten Synthese an ein Synthescharz gebunden. Festphasen-unterstützte Synthesemethoden sind in der Fachliteratur hinreichend beschrieben, z.B. Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998 und Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley, 1999. Die Verwendung von Festphasen-unterstützten Synthesemethoden erlaubt eine Reihe von literaturbekannten Protokollen, die wiederum manuell oder automatisiert ausgeführt werden können.

Sowohl an fester als auch in flüssiger Phase kann die Durchführung einzelner oder mehrerer Syntheseschritte durch den Einsatz der Mikrowellen-Technologie unterstützt werden. In der Fachliteratur sind eine Reihe von Versuchsprotokollen beschrieben, beispielsweise in Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (Herausgeber C. O. Kappe und A. Stadler), Verlag Wiley, 2005.

Die Herstellung gemäß der hier beschriebenen Verfahren liefert Verbindungen der Formel (I) und deren Salze in Form von Substanzkollektionen, die Bibliotheken genannt werden. Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Bibliotheken, die mindestens zwei Verbindungen der Formel (I) und deren Salzen enthalten.

Weiterer Gegenstand der Erfindung ist aufgrund der herbiziden Eigenschaft der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Herbizide zur Bekämpfung von Schadpflanzen.

Herbizide werden in landwirtschaftlich genutzten Kulturen während verschiedener Anbauphasen eingesetzt. So erfolgt die Applikation einiger Produkte schon vor oder während der Saat. Andere werden ausgebracht, bevor die Kulturpflanze aufläuft, d.h. bevor der Keimling die Erdoberfläche durchbricht (Vorauslauf-Herbizide). Nachauflauf-Herbizide schließlich werden verwendet, wenn von

der Kulturpflanze entweder bereits die Keimblätter oder Laubblätter ausgebildet sind.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können dabei sowohl im Vorlauf als auch im Nachlauf angewendet werden, wobei eine Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen im Vorlauf bevorzugt ist.

- 5 Die Voraufbau-Behandlung schließt sowohl die Behandlung der Anbaufläche vor der Aussaat (ppi = pre plant incorporation) als auch die Behandlung der angesäten, aber noch nicht bewachsenen Anbauflächen ein.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, im folgenden auch synonym zusammen auch als Verbindungen der Formel (I) bezeichnet, weisen eine ausgezeichnete herbizide

- 10 Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es gleichgültig, ob die Substanzen im Vorsaat-, Voraufbau- oder Nachaufbauverfahren ausgebracht werden.

- 15 Im einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

- Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z. B. *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachicaria*, *Bromus*, *Dactyloctenium*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleocharis*, *Eleusine*, *Festuca*, *Fimbristylis*, *Ischaemum*, *Lolium*, *Monochoria*, *Panicum*, *Paspalum*, *Phalaris*, *Phleum*, *Poa*, *Sagittaria*,
20 *Scirpus*, *Setaria*, *Sphenoclea*, sowie *Cyperus*arten vorwiegend aus der annualen Gruppe und auf Seiten der perennierenden Spezies *Agropyron*, *Cynodon*, *Imperata* sowie *Sorghum* und auch ausdauernde *Cyperus*arten gut erfaßt.

- Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Arten wie z. B. *Galium*, *Viola*, *Veronica*, *Lamium*, *Stellaria*, *Amaranthus*, *Sinapis*, *Ipomoea*, *Matricaria*, *Abutilon* und *Sida* auf der
25 annualen Seite sowie *Convolvulus*, *Cirsium*, *Rumex* und *Artemisia* bei den perennierenden Unkräutern. Außerdem wird herbizide Wirkung bei dikotylen Unkräutern wie *Ambrosia*, *Anthemis*, *Carduus*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Emex*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Lepidium*, *Lindernia*, *Papaver*, *Portulaca*, *Polygonum*, *Ranunculus*, *Rorippa*, *Rotala*, *Seneccio*, *Sesbania*, *Solanum*, *Sonchus*, *Taraxacum*, *Trifolium*, *Urtica* und *Xanthium* beobachtet.

- 30 Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und

sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe der allgemeinen Formel (I) auf die grünen Pflanzenteile im Nachaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstopp ein und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit ganz ab, so daß auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig beseitigt wird.

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen wie z. B. Weizen, Gerste, Roggen, Reis, Mais, Zuckerrübe, Baumwolle, Raps und Soja nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Substanzen der allgemeinen Formel (I) hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z. B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Desweiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativem Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Die erfindungsgemäßen Substanzen der allgemeinen Formel (I) können in Kombination mit weiteren Wirkstoffen, Pflanzenwachstumsregulatoren und/oder Safenern eingesetzt werden.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Verbindungen in Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe, die auf einer Inhibition von beispielsweise Acetolactat-Synthase, Acetyl-CoA-Carboxylase, Cellulose-Synthase, Enolpyruvylshikimat-3-phosphat-Synthase, Glutamin-Synthetase, p-Hydroxyphenylpyruvat-Dioxygenase, Phytoendesaturase, Photosystem I, Photosystem II oder Protoporphyrinogen-Oxidase beruhen, einsetzbar, wie sie z.B. aus Weed Research 26 (1986) 441-445 oder "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council und the Royal Soc. of Chemistry, 2006 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Nachfolgend werden beispielhaft bekannte Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren genannt, die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, wobei diese Wirkstoffe entweder mit ihrem "common name" in der englischsprachigen Variante gemäß International Organization for

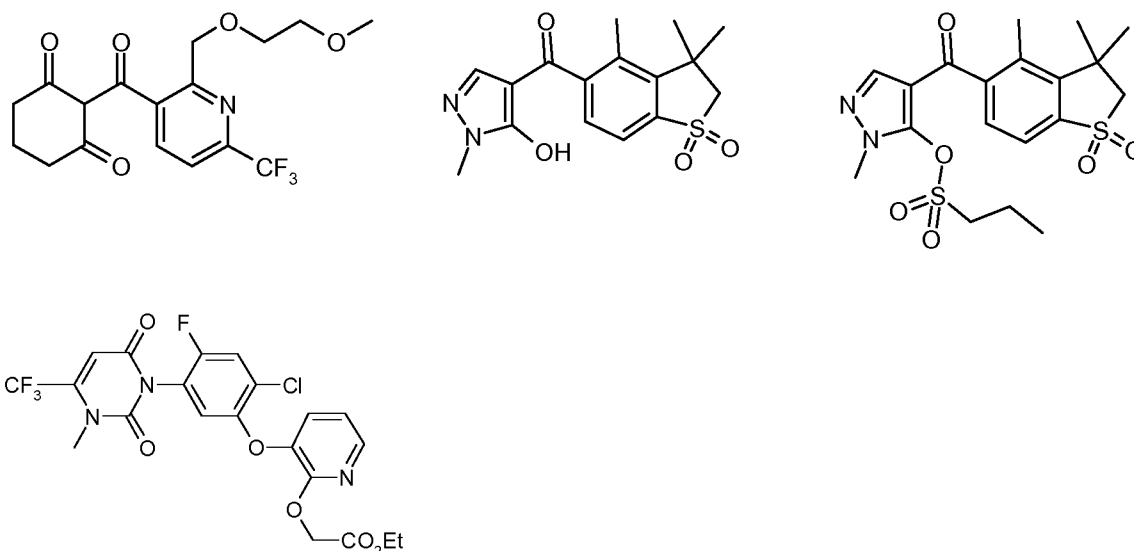
Standardization (ISO) oder mit dem chemischen Namen bzw. mit der Codenummer bezeichnet sind. Dabei sind stets sämtliche Anwendungsformen wie beispielsweise Säuren, Salze, Ester sowie auch alle isomeren Formen wie Stereoisomere und optische Isomere umfaßt, auch wenn diese nicht explizit erwähnt sind.

5 Beispiele für solche herbiziden Mischungspartner sind:

Acetochlor, acifluorfen, acifluorfen-sodium, aclonifen, alachlor, allidochlor, alloxydim, alloxydim-sodium, ametryn, amicarbazone, amidochlor, amidosulfuron, aminocyclopyrachlor, aminocyclopyrachlor-potassium, aminocyclopyrachlor-methyl, aminopyralid, amitrole, ammoniumsulfamate, anilofos, asulam, atrazine, azafenidin, azimsulfuron, beflubutamid, benazolin, benazolin-ethyl, 10 benfluralin, benfuresate, bensulfuron, bensulfuron-methyl, bensulide, bentazone, benzobicyclon, benzofenap, bicyclopyron, bifenox, bilanafos, bilanafos-sodium, bispyribac, bispyribac-sodium, bromacil, bromobutide, bromofenoxim, bromoxynil, bromoxynil-butyrate, -potassium, -heptanoate und -octanoate, busoxinone, butachlor, butafenacil, butamifos, butenachlor, butralin, butroxydim, butylate, cafenstrole, carbetamide, carfentrazone, carfentrazone-ethyl, chloramben, chlorbromuron, chlorfenac, 15 chlorfenac-sodium, chlorfenprop, chlorflurenol, chlorflurenol-methyl, chloridazon, chlorimuron, chlorimuron-ethyl, chlorophthalim, chlorotoluron, chlorthal-dimethyl, chlorsulfuron, 3-[5-Chlor-4-(trifluormethyl)pyridin-2-yl]-4-hydroxy-1-methylimidazolidin-2-on, cinidon, cinidon-ethyl, cinmethylin, cinosulfuron, clacyfos, clethodim, clodinafop, clodinafop-propargyl, clomazone, clomeprop, clopyralid, cloransulam, cloransulam-methyl, cumyluron, cyanamide, cyanazine, cycloate, cyclopyranil, 20 cyclopyrimorate, cyclosulfamuron, cycloxydim, cyhalofop, cyhalofop-butyl, cyprazine, 2,4-D, 2,4-D-butotyl, -butyl, -dimethylammonium, -diolamin, -ethyl, 2-ethylhexyl, -isobutyl, -isooctyl, -isopropylammonium, -potassium, -triisopropanolammonium und -trolamine, 2,4-DB, 2,4-DB-butyl, -dimethylammonium, isooctyl, -potassium und -sodium, daimuron (dymron), dalapon, dazomet, n-decanol, desmedipham, detosyl-pyrazolate (DTP), dicamba, dichlobenil, 2-(2,4-dichlorobenzyl)-4,4-dimethyl-1,2-oxazolidin-3-one, 2-(2,5-dichlorobenzyl)-4,4-dimethyl-1,2-oxazolidin-3-one, dichlorprop, 25 dichlorprop-P, diclofop, diclofop-methyl, diclofop-P-methyl, diclosulam, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopyr, diflufenzopyr-sodium, dimefuron, dimepiperate, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dimethenamid-P, dimetrasulfuron, dinitramine, dinoterb, diphenamid, diquat, diquat-dibromid, dithiopyr, diuron, DNOC, endothal, EPTC, esprocarb, ethalfluralin, ethametsulfuron, ethamet-sulfuron-methyl, ethiozin, ethofumesate, ethoxyfen, ethoxyfen-ethyl, ethoxysulfuron, etobenzanid, F- 30 9600, F-5231, i.e. N-[2-Chlor-4-fluor-5-[4-(3-fluorpropyl)-4,5-dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid, F-7967, i.e. 3-[7-Chlor-5-fluor-2-(trifluormethyl)-1H-benzimidazol-4-yl]-1-methyl-6-(trifluormethyl)pyrimidin-2,4(1H,3H)-dion, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-ethyl, fenoxaprop-P-ethyl, fenoxasulfone, fenquino-trione, fentrazamide, flamprop, flamprop-M-isopropyl, flamprop-M-methyl, flazasulfuron, florasulam, florpyrauxifen, florpyrauxifen-benzyl, fluazifop, fluazifop-P, 35 fluazifop-butyl, fluazifop-P-butyl, flucarbazone, flucarbazone-sodium, flucetosulfuron, fluchloralin,

flufenacet, flufenpyr, flufenpyr-ethyl, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, fluometuron, flurenol, flurenol-butyl, -dimethylammonium und -methyl, fluoroglycofen, fluoroglycofen-ethyl, flupropanate, flupyr-sulfuron, flupyr-sulfuron-methyl-sodium, fluridone, flurochloridone, fluroxypyr, fluroxypyr-meptyl, flurtamone, fluthiacet, fluthiacet-methyl, fomesafen, fomesafen-sodium, 5 foramsulfuron, fosamine, glufosinate, glufosinate-ammonium, glufosinate-P-sodium, glufosinate-P-ammonium, glufosinate-P-sodium, glyphosate, glyphosate-ammonium, -isopropyl-ammonium, -diammonium, -dimethylammonium, -potassium, -sodium und -trimesium, H-9201, i.e. O-(2,4-Dimethyl-6-nitrophenyl)-O-ethyl-isopropylphosphoramidothioat, halauxifen, halauxifen-methyl, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-methyl, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-ethoxyethyl, 10 haloxyfop-P-ethoxyethyl, haloxyfop-methyl, haloxyfop-P-methyl, hexazinone, HW-02, i.e. 1-(Dimethoxyphosphoryl)-ethyl-(2,4-dichlorphenoxy)acetat, 4-Hydroxy-1-methoxy-5-methyl-3-[4-(trifluormethyl)pyridin-2-yl]imidazolidin-2-on, 4-Hydroxy-1-methyl-3-[4-(trifluormethyl)pyridin-2-yl]imidazolidin-2-on, imazamethabenz, Imazamethabenz-methyl, imazamox, imazamox-ammonium, imazapic, imazapic-ammonium, imazapyr, imazapyr-isopropylammonium, imazaquin, imazaquin-15 ammonium, imazethapyr, imazethapyr-immonium, imazosulfuron, indanofan, indaziflam, iodofenoxuron, iodofenoxuron-methyl-sodium, ioxynil, ioxynil-octanoate, -potassium und sodium, ipfencarbazone, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutole, karbutilate, KUH-043, i.e. 3-({[5-(Difluormethyl)-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl]methyl}sulfonyl)-5,5-dimethyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol, ketospiradox, lactofen, lenacil, linuron, MCPA, MCPA-butotyl, -dimethylammonium, -2-ethylhexyl, -20 isopropylammonium, -potassium und -sodium, MCPB, MCPB-methyl, -ethyl und -sodium, mecoprop, mecoprop-sodium, und -butotyl, mecoprop-P, mecoprop-P-butotyl, -dimethylammonium, -2-ethylhexyl und -potassium, mefenacet, mefluidide, mesosulfuron, mesosulfuron-methyl, mesotrione, methabenzthiazuron, metam, metamifop, metamitron, metazachlor, metazosulfuron, methabenzthiazuron, methiopyrsulfuron, methiozolin, methyl isothiocyanate, metobromuron, 25 metolachlor, S-metolachlor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, metsulfuron-methyl, molinat, monolinuron, monosulfuron, monosulfuron-ester, MT-5950, i.e. N-[3-chlor-4-(1-methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid, NGGC-011, napropamide, NC-310, i.e. 4-(2,4-Dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-benzyloxy-pyrazol, neburon, nicosulfuron, nonanoic acid (Pelargonsäure), norflurazon, oleic acid (fatty acids), orbencarb, orthosulfamuron, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefon, 30 oxotrione (lancotrione), oxyfluorfen, paraquat, paraquat dichloride, pebulate, pendimethalin, penoxsulam, pentachlorphenol, pentoxazone, pethoxamid, petroleum oils, phenmedipham, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperophos, pretilachlor, primisulfuron, primisulfuron-methyl, prodiamine, profoxydim, prometon, prometryn, propachlor, propanil, propaquizafop, propazine, propham, prop-isochlor, propoxycarbazone, propoxycarbazone-sodium, propyrisulfuron, propyzamide, prosulfocarb, prosulfuron, pyraclonil, pyraflufen, pyraflufen-ethyl, pyrasulfotole, pyrazolynate (pyrazolate), pyrazo-35 sulfuron, pyrazosulfuron-ethyl, pyrazoxyfen, pyribambenz, pyribambenz-isopropyl, pyribambenz-propyl, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, pyridate, pyriftalid, pyriminobac, pyriminobac-methyl,

pyrimisulfan, pyriithiobac, pyriithiobac-sodium, pyroxasulfone, pyroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinochloramine, quizalofop, quizalofop-ethyl, quizalofop-P, quizalofop-P-ethyl, quizalofop-P-tefuryl, rimsulfuron, saflufenacil, sethoxydim, siduron, simazine, simetryn, sulcotrion, sulfentrazone, sulfometuron, sulfometuron-methyl, sulfosulfuron, , SYN-523, SYP-249, i.e. 1-Ethoxy-3-methyl-1-oxobut-
 5 3-en-2-yl-5-[2-chlor-4-(trifluormethyl)phenoxy]-2-nitrobenzoat, SYP-300, i.e. 1-[7-Fluor-3-oxo-4-(prop-2-in-1-yl)-3,4-dihydro-2H-1,4-benzoxazin-6-yl]-3-propyl-2-thioxoimidazolidin-4,5-dion, 2,3,6-TBA, TCA (Trifluoressigsäure), TCA-sodium, tebuthiuron, tefuryltrione, tembotrione, tepraloxymid, terbacil, terbucarb, terbumeton, terbuthylazin, terbutryn, thenylchlor, thiazopyr, thiencarbazone, thiencarbazone-methyl, thifensulfuron, thifensulfuron-methyl, thiobencarb, tiafenacil, tolpyralate,
 10 topramezone, tralkoxydim, triafamone, tri-allate, triasulfuron, triaziflam, tribenuron, tribenuron-methyl, triclopyr, trietazine, trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-sodium, trifludimoxazin, trifluralin, triflusulfuron, triflusulfuron-methyl, tritosulfuron, urea sulfate, vernolate, ZJ-0862, i.e. 3,4-Dichlor-N-{2-[(4,6-dimethoxy-2-pyrimidin-2-yl)oxy]benzyl}anilin, sowie die folgenden Verbindungen:



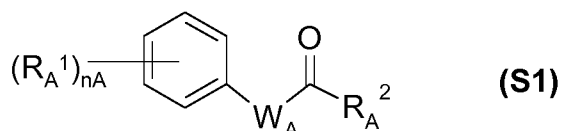
15 Beispiele für Pflanzenwachstumsregulatoren als mögliche Mischungspartner sind:

Acibenzolar, acibenzolar-S-methyl, 5-Aminolävulinsäure, ancymidol, 6-benzylaminopurine, Brassinolid, Catechin, chlormequat chloride, cloprop, cyclanilide, 3-(Cycloprop-1-enyl)propionsäure, daminozide, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-sodium, endothal, endothal-
 20 dipotassium, -disodium, und mono(N,N-dimethylalkylammonium), ethephon, flumetralin, flurenol, flurenol-butyl, flurprimidol, forchlorfenuron, gibberellic acid, inabenfide, indol-3-acetic acid (IAA), 4-indol-3-ylbutyric acid, isoprothiolane, probenazole, Jasmonsäure, Jasmonsäuremethylester, maleic hydrazide, mepiquat chloride, 1-methylcyclopropene, 2-(1-naphthyl)acetamide, 1-naphthylacetic acid, 2-naphthoxyacetic acid, nitrophenolate-mixture, 4-Oxo-4[(2-phenylethyl)amino]buttersäure,

paclobutrazol, N-phenylphthalamic acid, prohexadione, prohexadione-calcium, prohydrojasmon, Salicylsäure, Strigolacton, tecnazene, thidiazuron, triacantanol, trinexapac, trinexapac-ethyl, tsitodef, uniconazole, uniconazole-P.

5 Die Safener sind vorzugsweise ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus:

S1) Verbindungen der Formel (S1),

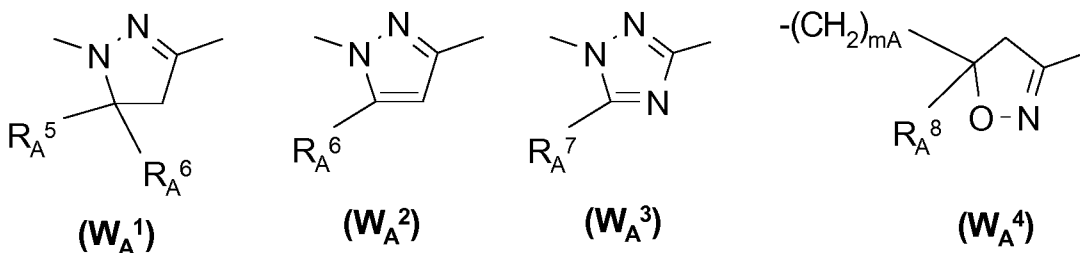


wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

n_A ist eine natürliche Zahl von 0 bis 5, vorzugsweise 0 bis 3;

10 R_A^1 ist Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, Nitro oder (C₁-C₄)Haloalkyl;

W_A ist ein unsubstituierter oder substituierter divalenter heterocyclischer Rest aus der Gruppe der teilungesättigten oder aromatischen Fünfring-Heterocyclen mit 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N und O, wobei mindestens ein N-Atom und höchstens ein O-Atom im Ring enthalten ist, vorzugsweise ein Rest aus der Gruppe (W_A^1) bis (W_A^4),



15 m_A ist 0 oder 1;

R_A^2 ist OR_A^3 , SR_A^3 oder $NR_A^3R_A^4$ oder ein gesättigter oder ungesättigter 3- bis 7-gliedriger Heterocyclus mit mindestens einem N-Atom und bis zu 3 Heteroatomen, vorzugsweise aus der Gruppe O und S, der über das N-Atom mit der Carbonylgruppe in (S1) verbunden ist und unsubstituiert oder durch Reste aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy oder

gegebenenfalls substituiertes Phenyl substituiert ist, vorzugsweise ein Rest der Formel OR_A^3 , NHR_A^4 oder $N(CH_3)_2$, insbesondere der Formel OR_A^3 ;

R_A^3 ist Wasserstoff oder ein unsubstituierter oder substituierter aliphatischer Kohlenwasserstoffrest, vorzugsweise mit insgesamt 1 bis 18 C-Atomen;

5 R_A^4 ist Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_6) Alkoxy oder substituiertes oder unsubstituiertes Phenyl;

R_A^5 ist H, (C_1-C_8) Alkyl, (C_1-C_8) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy (C_1-C_8) Alkyl, Cyano oder $COOR_A^9$, worin R_A^9 Wasserstoff, (C_1-C_8) Alkyl, (C_1-C_8) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_6) Hydroxyalkyl, (C_3-C_{12}) Cycloalkyl oder Tri- (C_1-C_4) -alkyl-silyl ist;

10 R_A^6 , R_A^7 , R_A^8 sind gleich oder verschieden Wasserstoff, (C_1-C_8) Alkyl, (C_1-C_8) Haloalkyl, (C_3-C_{12}) Cycloalkyl oder substituiertes oder unsubstituiertes Phenyl;

vorzugsweise:

a) Verbindungen vom Typ der Dichlorphenylpyrazolin-3-carbonsäure ($S1^a$), vorzugsweise Verbindungen wie 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(ethoxycarbonyl)-5-methyl-2-pyrazolin-3-carbonsäure, 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(ethoxycarbonyl)-5-methyl-2-pyrazolin-3-carbonsäureethylester (S1-1) ("Mefenpyr-diethyl"), und verwandte Verbindungen, wie sie in der WO-A-91/07874 beschrieben sind;

b) Derivate der Dichlorphenylpyrazolcarbonsäure ($S1^b$), vorzugsweise Verbindungen wie 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-methyl-pyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-2), 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-isopropyl-pyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-3), 20 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-(1,1-dimethyl-ethyl)pyrazol-3-carbonsäureethyl-ester (S1-4) und verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-333 131 und EP-A-269 806 beschrieben sind;

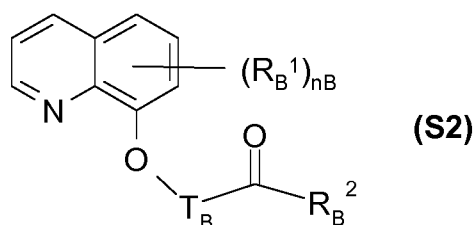
c) Derivate der 1,5-Diphenylpyrazol-3-carbonsäure ($S1^c$), vorzugsweise Verbindungen wie 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-phenylpyrazol-3-carbonsäureethylester (S1-5), 1-(2-Chlorphenyl)-5-phenylpyrazol-3-carbonsäuremethylester (S1-6) und verwandte 25 Verbindungen wie sie beispielsweise in der EP-A-268554 beschrieben sind;

d) Verbindungen vom Typ der Triazolcarbonsäuren ($S1^d$), vorzugsweise Verbindungen wie Fenchlorazol(-ethylester), d.h. 1-(2,4-Dichlorphenyl)-5-trichlormethyl-(1H)-1,2,4-triazol-3-carbonsäureethylester (S1-7), und verwandte Verbindungen wie sie in EP-A-174 562 und EP-A-346 620 beschrieben sind;

30 e) Verbindungen vom Typ der 5-Benzyl- oder 5-Phenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäure oder der 5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäure ($S1^e$), vorzugsweise Verbindungen wie

5-(2,4-Dichlorbenzyl)-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-8) oder
 5-Phenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-9) und verwandte Verbindungen, wie sie in
 WO-A-91/08202 beschrieben sind, bzw. 5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäure (S1-10) oder
 5,5-Diphenyl-2-isoxazolin-3-carbonsäureethylester (S1-11) ("Isoxadifen-ethyl")
 5 oder -n-propylester (S1-12) oder der 5-(4-Fluorphenyl)-5-phenyl-2-isoxazolin-3-
 carbonsäureethylester (S1-13), wie sie in der Patentanmeldung WO-A-95/07897 beschrieben
 sind.

S2) Chinolinderivate der Formel (S2),



wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

10 R_B^1 ist Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, Nitro oder (C₁-C₄)Haloalkyl;

n_B ist eine natürliche Zahl von 0 bis 5, vorzugsweise 0 bis 3;

R_B^2 ist OR_B^3 , SR_B^3 oder $NR_B^3R_B^4$ oder ein gesättigter

oder ungesättigter 3- bis 7-gliedriger Heterocyclus mit mindestens einem N-Atom und bis zu 3
 Heteroatomen, vorzugsweise aus der Gruppe O und S, der über das N-Atom mit der

15 Carbonylgruppe in (S2) verbunden ist und unsubstituiert oder durch Reste aus der Gruppe (C₁-
 C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl substituiert ist, vorzugsweise
 ein Rest der Formel OR_B^3 , NHR_B^4 oder $N(CH_3)_2$, insbesondere der Formel OR_B^3 ;

R_B^3 ist Wasserstoff oder ein unsubstituierter oder substituierter aliphatischer Kohlenwasserstoffrest,
 vorzugsweise mit insgesamt 1 bis 18 C-Atomen;

20 R_B^4 ist Wasserstoff, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy oder substituiertes oder unsubstituiertes Phenyl;

T_B ist eine (C₁ oder C₂)-Alkandiyolkette, die unsubstituiert oder mit einem oder zwei (C₁-
 C₄)Alkylresten oder mit [(C₁-C₃)-Alkoxy]-carbonyl substituiert ist;

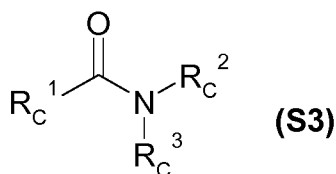
vorzugsweise:

a) Verbindungen vom Typ der 8-Chinolinoxinessigsäure (S2^a), vorzugsweise

25 (5-Chlor-8-chinolinoxinessigsäure-(1-methylhexyl)ester ("Cloquintocet-mexyl") (S2-1),

- (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäure-(1,3-dimethyl-but-1-yl)ester (S2-2),
 (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäure-4-allyloxy-butylester (S2-3),
 (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäure-1-allyloxy-prop-2-ylester (S2-4),
 (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäureethylester (S2-5),
 5 (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäuremethylester (S2-6),
 (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäureallylester (S2-7),
 (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäure-2-(2-propyliden-iminoxy)-1-ethylester (S2-8), (5-Chlor-8-
 chinolinoxy)essigsäure-2-oxo-prop-1-ylester (S2-9) und verwandte Verbindungen, wie sie in
 EP-A-86 750, EP-A-94 349 und EP-A-191 736 oder EP-A-0 492 366 beschrieben sind, sowie
 10 (5-Chlor-8-chinolinoxy)essigsäure (S2-10), deren Hydrate und Salze, beispielsweise deren
 Lithium-, Natrium- Kalium-, Kalzium-, Magnesium-, Aluminium-, Eisen-, Ammonium-,
 quartäre Ammonium-, Sulfonium-, oder Phosphoniumsalze wie sie in der WO-A-2002/34048
 beschrieben sind;
- b) Verbindungen vom Typ der (5-Chlor-8-chinolinoxy)malonsäure (S2^b), vorzugsweise
 15 Verbindungen wie (5-Chlor-8-chinolinoxy)malonsäurediethylester,
 (5-Chlor-8-chinolinoxy)malonsäurediallylester, (5-Chlor-8-chinolinoxy)
 malonsäure-methyl-ethylester und verwandte Verbindungen, wie sie in EP-A-0 582 198
 beschrieben sind.

S3) Verbindungen der Formel (S3)



20

wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

R_C¹ ist (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₂-C₄)Alkenyl, (C₂-C₄)Haloalkenyl, (C₃-C₇)Cycloalkyl,
 vorzugsweise Dichlormethyl;

25 R_C², R_C³ sind gleich oder verschieden Wasserstoff, (C₁-C₄)Alkyl, (C₂-C₄)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkynyl, (C₁-
 C₄)Haloalkyl, (C₂-C₄)Haloalkenyl, (C₁-C₄)Alkylcarbamoyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-
 C₄)Alkenylcarbamoyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Dioxolanyl-(C₁-C₄)alkyl,
 Thiazolyl, Furyl, Furylalkyl, Thienyl, Piperidyl, substituiertes oder unsubstituiertes Phenyl, oder
 R_C² und R_C³ bilden zusammen einen substituierten oder unsubstituierten heterocyclischen Ring,

vorzugsweise einen Oxazolidin-, Thiazolidin-, Piperidin-, Morpholin-, Hexahydropyrimidin- oder Benzoxazinring;

vorzugsweise:

Wirkstoffe vom Typ der Dichloracetamide, die häufig als Voraufbauafener (bodenwirksame

5

Safener) angewendet werden, wie z. B.

"Dichlormid" (N,N-Diallyl-2,2-dichloracetamid) (S3-1),

"R-29148" (3-Dichloracetyl-2,2,5-trimethyl-1,3-oxazolidin) der Firma Stauffer (S3-2),

"R-28725" (3-Dichloracetyl-2,2,-dimethyl-1,3-oxazolidin) der Firma Stauffer (S3-3),

"Benoxacor" (4-Dichloracetyl-3,4-dihydro-3-methyl-2H-1,4-benzoxazin) (S3-4),

10

"PPG-1292" (N-Allyl-N-[(1,3-dioxolan-2-yl)-methyl]-dichloracetamid) der Firma PPG Industries (S3-5),

"DKA-24" (N-Allyl-N-[(allylaminocarbonyl)methyl]-dichloracetamid) der Firma Sagro-Chem (S3-6),

"AD-67" oder "MON 4660" (3-Dichloracetyl-1-oxa-3-aza-spiro[4,5]decan) der Firma

15

Nitrokemia bzw. Monsanto (S3-7),

"TI-35" (1-Dichloracetyl-azepan) der Firma TRI-Chemical RT (S3-8),

"Diclonon" (Dicyclonon) oder "BAS145138" oder "LAB145138" (S3-9)

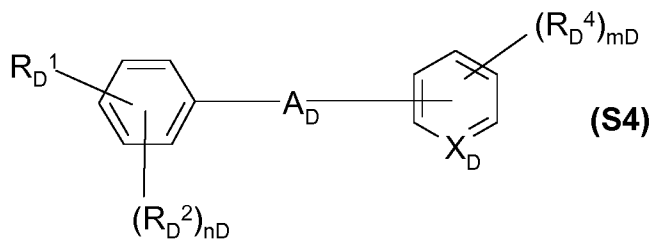
((RS)-1-Dichloracetyl-3,3,8a-trimethylperhydropyrrolo[1,2-a]pyrimidin-6-on) der Firma BASF,

"Furilazol" oder "MON 13900" ((RS)-3-Dichloracetyl-5-(2-furyl)-2,2-dimethyloxazolidin)

20

(S3-10); sowie dessen (R)-Isomer (S3-11).

S4) N-Acylsulfonamide der Formel (S4) und ihre Salze,



worin die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

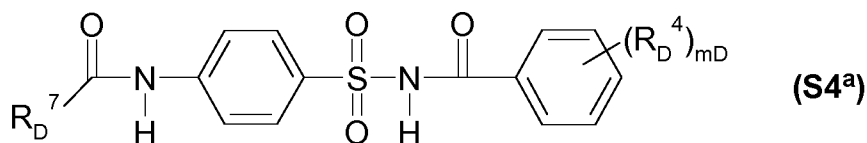
25 A_D ist $SO_2-NR_D^3-CO$ oder $CO-NR_D^3-SO_2$

X_D ist CH oder N;

R_D^1 ist $CO-NR_D^5R_D^6$ oder $NHCO-R_D^7$;

- R_D^2 ist Halogen, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Nitro, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl oder (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl;
- R_D^3 ist Wasserstoff, (C₁-C₄)Alkyl, (C₂-C₄)Alkenyl oder (C₂-C₄)Alkynyl;
- R_D^4 ist Halogen, Nitro, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₃-C₆)Cycloalkyl, Phenyl, (C₁-C₄)Alkoxy, Cyano, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl oder (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl;
- R_D^5 ist Wasserstoff, (C₁-C₆)Alkyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkynyl, (C₅-C₆)Cycloalkenyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclenyl enthaltend v_D Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei die sieben letztgenannten Reste durch v_D Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₆)Haloalkoxy, (C₁-C₂)Alkylsulfinyl, (C₁-C₂)Alkylsulfonyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl und Phenyl und im Falle cyclischer Reste auch (C₁-C₄) Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert sind;
- R_D^6 ist Wasserstoff, (C₁-C₆)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl oder (C₂-C₆)Alkynyl, wobei die drei letztgenannten Reste durch v_D Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio substituiert sind, oder
- R_D^5 und R_D^6 gemeinsam mit dem dem sie tragenden Stickstoffatom einen Pyrrolidinyl- oder Piperidinyl-Rest bilden;
- R_D^7 ist Wasserstoff, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-(C₁-C₄)alkylamino, (C₁-C₆)Alkyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, wobei die 2 letztgenannten Reste durch v_D Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₆)Haloalkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio und im Falle cyclischer Reste auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert sind;
- n_D ist 0, 1 oder 2;
- m_D ist 1 oder 2;
- v_D ist 0, 1, 2 oder 3;

davon bevorzugt sind Verbindungen vom Typ der N-Acylsulfonamide, z.B. der nachfolgenden Formel (S4^a), die z. B. bekannt sind aus WO-A-97/45016



worin

R_D^7 (C₁-C₆)Alkyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, wobei die 2 letztgenannten Reste durch v_D Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₆)Haloalkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio und im Falle cyclischer Reste auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert sind;

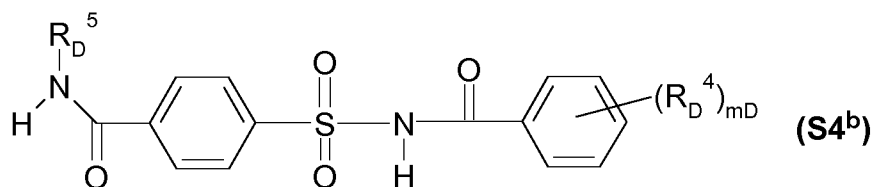
5 R_D^4 Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, CF₃;

m_D 1 oder 2;

v_D ist 0, 1, 2 oder 3 bedeutet;

sowie

10 Acylsulfamoylbenzoesäureamide, z.B. der nachfolgenden Formel (S4^b), die z.B. bekannt sind aus WO-A-99/16744,



z.B. solche worin

R_D^5 = Cyclopropyl und $(R_D^4) = 2$ -OMe ist ("Cyprosulfamide", S4-1),

R_D^5 = Cyclopropyl und $(R_D^4) = 5$ -Cl-2-OMe ist (S4-2),

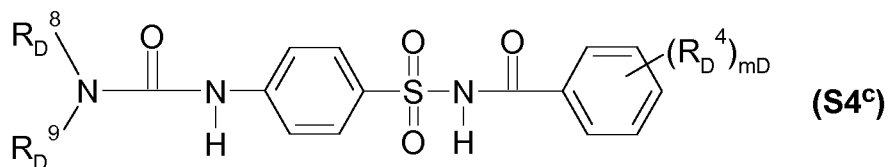
15 R_D^5 = Ethyl und $(R_D^4) = 2$ -OMe ist (S4-3),

R_D^5 = Isopropyl und $(R_D^4) = 5$ -Cl-2-OMe ist (S4-4) und

R_D^5 = Isopropyl und $(R_D^4) = 2$ -OMe ist (S4-5).

sowie

20 Verbindungen vom Typ der N-Acylsulfamoylphenylharnstoffe der Formel (S4^c), die z.B. bekannt sind aus der EP-A-365484,



worin

R_D^8 und R_D^9 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_8) Alkyl, (C_3-C_8) Cycloalkyl, (C_3-C_6) Alkenyl, (C_3-C_6) Alkinyl,

R_D^4 Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, CF_3

5 m_D 1 oder 2 bedeutet;

beispielsweise

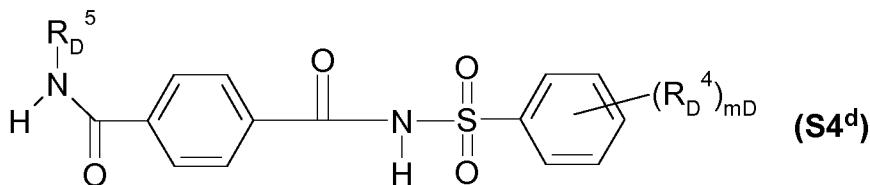
1-[4-(N-2-Methoxybenzoylsulfamoyl)phenyl]-3-methylharnstoff („Metcamifen“, S4-6),

1-[4-(N-2-Methoxybenzoylsulfamoyl)phenyl]-3,3-dimethylharnstoff,

1-[4-(N-4,5-Dimethylbenzoylsulfamoyl)phenyl]-3-methylharnstoff,

10 sowie

N-Phenylsulfonylterephthalamide der Formel (S4^d), die z.B. bekannt sind aus CN 101838227,



z.B. solche worin

R_D^4 Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, CF_3 ;

15 m_D 1 oder 2;

R_D^5 Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_5-C_6) Cycloalkenyl bedeutet.

S5) Wirkstoffe aus der Klasse der Hydroxyaromaten und der aromatisch-aliphatischen Carbonsäurederivate (S5), z.B.

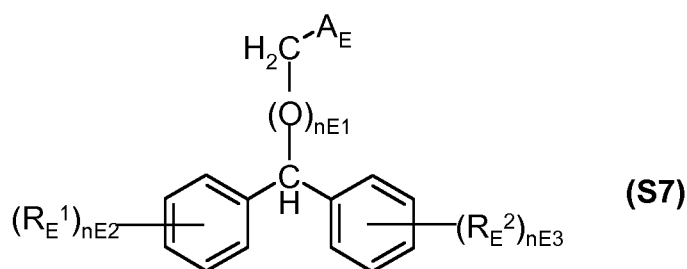
20 3,4,5-Triacetoxybenzoesäureethylester, 3,5-Dimethoxy-4-hydroxybenzoesäure, 3,5-Dihydroxybenzoesäure, 4-Hydroxysalicylsäure, 4-Fluorsalicylsäure, 2-Hydroxyzimtsäure, 2,4-Dichlorzimtsäure, wie sie in der WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001 beschrieben sind.

S6) Wirkstoffe aus der Klasse der 1,2-Dihydrochinoxalin-2-one (S6), z.B.

25 1-Methyl-3-(2-thienyl)-1,2-dihydrochinoxalin-2-on, 1-Methyl-3-(2-thienyl)-1,2-dihydro-

chinoxalin-2-thion, 1-(2-Aminoethyl)-3-(2-thienyl)-1,2-dihydro-chinoxalin-2-on-hydrochlorid, 1-(2-Methylsulfonylaminoethyl)-3-(2-thienyl)-1,2-dihydro-chinoxalin-2-on, wie sie in der WO-A-2005/112630 beschrieben sind.

S7) Verbindungen der Formel (S7), wie sie in der WO-A-1998/38856 beschrieben sind



5

worin die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

R_E^1, R_E^2 sind unabhängig voneinander Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-(C₁-C₄)Alkylamino, Nitro;

A_E ist COOR_E³ oder COSR_E⁴

10 R_E^3, R_E^4 sind unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₄)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkynyl, Cyanoalkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, Phenyl, Nitrophenyl, Benzyl, Halobenzyl, Pyridinylalkyl und Alkylammonium,

n_E^1 ist 0 oder 1

n_E^2, n_E^3 sind unabhängig voneinander 0, 1 oder 2,

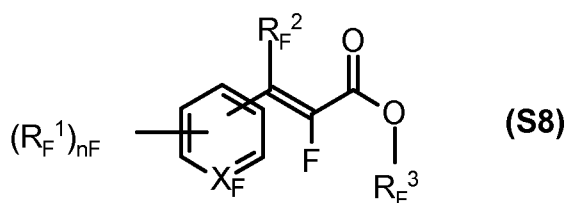
15 vorzugsweise:

Diphenylmethoxyessigsäure,

Diphenylmethoxyessigsäureethylester,

Diphenylmethoxyessigsäuremethylester (CAS-Reg.Nr. 41858-19-9) (S7-1).

S8) Verbindungen der Formel (S8), wie sie in der WO-A-98/27049 beschrieben sind



20

worin

X_F CH oder N,

n_F für den Fall, dass $X_F=N$ ist, eine ganze Zahl von 0 bis 4 und

für den Fall, dass $X_F=CH$ ist, eine ganze Zahl von 0 bis 5 ,

5 R_F^1 Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Nitro, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, ggf. substituiertes. Phenyl, ggf. substituiertes Phenoxy,

R_F^2 Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl

10 R_F^3 Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, (C₂-C₄)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkynyl, oder Aryl, wobei jeder der vorgenannten C-haltigen Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe, bestehend aus Halogen und Alkoxy substituiert ist; bedeuten, oder deren Salze,

vorzugsweise Verbindungen worin

X_F CH,

15 n_F eine ganze Zahl von 0 bis 2 ,

R_F^1 Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy,

R_F^2 Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl,

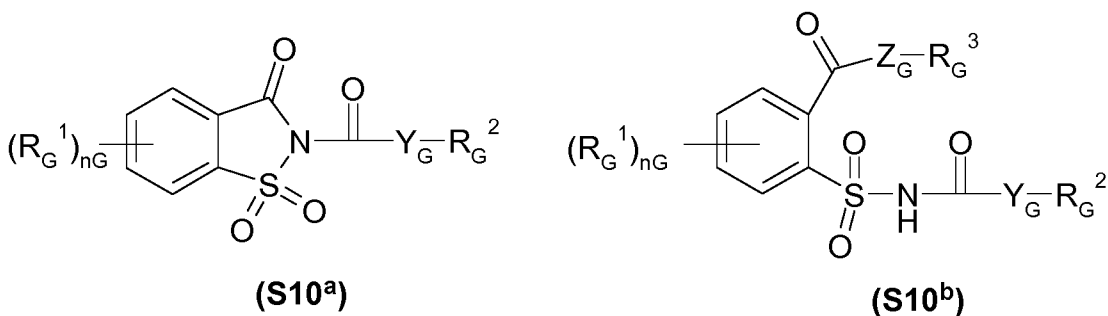
20 R_F^3 Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, (C₂-C₄)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkynyl, oder Aryl, wobei jeder der vorgenannten C-haltigen Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe, bestehend aus Halogen und Alkoxy substituiert ist, bedeuten, oder deren Salze.

S9) Wirkstoffe aus der Klasse der 3-(5-Tetrazolylcarbonyl)-2-chinolone (S9), z.B.

25 1,2-Dihydro-4-hydroxy-1-ethyl-3-(5-tetrazolylcarbonyl)-2-chinolon (CAS-Reg.Nr. 219479-18-2), 1,2-Dihydro-4-hydroxy-1-methyl-3-(5-tetrazolyl-carbonyl)-2-chinolon (CAS-Reg.Nr. 95855-00-8), wie sie in der WO-A-1999/000020 beschrieben sind.

S10) Verbindungen der Formeln (S10^a) oder (S10^b)

wie sie in der WO-A-2007/023719 und WO-A-2007/023764 beschrieben sind



worin

- 5 R_G^1 Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, Methoxy, Nitro, Cyano, CF₃, OCF₃
- Y_G, Z_G unabhängig voneinander O oder S,
- n_G eine ganze Zahl von 0 bis 4,
- R_G^2 (C₁-C₁₆)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, Aryl; Benzyl, Halogenbenzyl,
- R_G^3 Wasserstoff oder (C₁-C₆)Alkyl bedeutet.
- 10 S11) Wirkstoffe vom Typ der Oxyimino-Verbindungen (S11), die als Saatbeizmittel bekannt sind, wie z. B.
- "Oxabetrinil" ((Z)-1,3-Dioxolan-2-ylmethoxyimino(phenyl)acetonitril) (S11-1), das als Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Metolachlor bekannt ist,
- "Fluxofenim" (1-(4-Chlorphenyl)-2,2,2-trifluor-1-ethanon-O-(1,3-dioxolan-2-ylmethyl)-oxim) (S11-2), das als Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Metolachlor bekannt ist, und
- 15 "Cyometrinil" oder "CGA-43089" ((Z)-Cyanomethoxyimino(phenyl)acetonitril) (S11-3), das als Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Metolachlor bekannt ist.
- S12) Wirkstoffe aus der Klasse der Isothiochromanone (S12), wie z.B. Methyl-[(3-oxo-1H-2-benzothiopyran-4(3H)-yliden)methoxy]acetat (CAS-Reg.Nr. 205121-04-6) (S12-1) und
- 20 verwandte Verbindungen aus WO-A-1998/13361.
- S13) Eine oder mehrere Verbindungen aus Gruppe (S13):
- "Naphthalic anhydrid" (1,8-Naphthalindicarbonsäureanhydrid) (S13-1), das als Saatbeiz-Safener für Mais gegen Schäden von Thiocarbamatherbiziden bekannt ist,

"Fenclorim" (4,6-Dichlor-2-phenylpyrimidin) (S13-2), das als Safener für Pretilachlor in gesättem Reis bekannt ist,

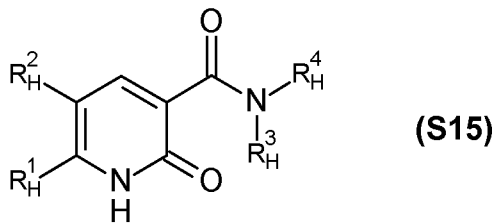
"Flurazole" (Benzyl-2-chlor-4-trifluormethyl-1,3-thiazol-5-carboxylat) (S13-3), das als Saatbeiz-Safener für Hirse gegen Schäden von Alachlor und Metolachlor bekannt ist,

- 5 "CL 304415" (CAS-Reg.Nr. 31541-57-8)
(4-Carboxy-3,4-dihydro-2H-1-benzopyran-4-essigsäure) (S13-4) der Firma American Cyanamid, das als Safener für Mais gegen Schäden von Imidazolinonen bekannt ist,
- "MG 191" (CAS-Reg.Nr. 96420-72-3) (2-Dichlormethyl-2-methyl-1,3-dioxolan) (S13-5) der Firma Nitrokemia, das als Safener für Mais bekannt ist,

- 10 "MG 838" (CAS-Reg.Nr. 133993-74-5)
(2-propenyl 1-oxa-4-azaspiro[4.5]decan-4-carbodithioat) (S13-6) der Firma Nitrokemia,
- "Disulfoton" (O,O-Diethyl S-2-ethylthioethyl phosphordithioat) (S13-7),
- "Dietholate" (O,O-Diethyl-O-phenylphosphorothioat) (S13-8),
- "Mephenate" (4-Chlorphenyl-methylcarbamat) (S13-9).

- 15 S14) Wirkstoffe, die neben einer herbiziden Wirkung gegen Schädnpflanzen auch Safenerwirkung an Kulturpflanzen wie Reis aufweisen, wie z. B.
- "Dimepiperate" oder "MY 93" (S-1-Methyl-1-phenylethyl-piperidin-1-carbothioat), das als Safener für Reis gegen Schäden des Herbizids Molinate bekannt ist,
- "Daimuron" oder "SK 23" (1-(1-Methyl-1-phenylethyl)-3-p-tolyl-harnstoff), das als Safener für
20 Reis gegen Schäden des Herbizids Imazosulfuron bekannt ist,
- "Cumyluron" = "JC 940" (3-(2-Chlorphenylmethyl)-1-(1-methyl-1-phenyl-ethyl)harnstoff, siehe JP-A-60087254), das als Safener für Reis gegen Schäden einiger Herbizide bekannt ist,
- "Methoxyphenon" oder "NK 049" (3,3'-Dimethyl-4-methoxy-benzophenon), das als Safener für
25 Reis gegen Schäden einiger Herbizide bekannt ist,
- "CSB" (1-Brom-4-(chlormethylsulfonyl)benzol) von Kumiai, (CAS-Reg.Nr. 54091-06-4), das als Safener gegen Schäden einiger Herbizide in Reis bekannt ist.

S15) Verbindungen der Formel (S15) oder deren Tautomere



wie sie in der WO-A-2008/131861 und WO-A-2008/131860 beschrieben sind

worin

R_H^1 einen (C₁-C₆)Haloalkylrest bedeutet und

5 R_H^2 Wasserstoff oder Halogen bedeutet und

R_H^3, R_H^4 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₁₆)Alkyl, (C₂-C₁₆)Alkenyl oder (C₂-C₁₆)Alkinyl,

wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, Cyano, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Alkylamino, Di[(C₁-C₄)alkyl]-amino, [(C₁-C₄)Alkoxy]-carbonyl, [(C₁-C₄)Haloalkoxy]-carbonyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, Phenyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, und Heterocyclyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, substituiert ist,

10

oder (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₄-C₆)Cycloalkenyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, das an einer Seite des Rings mit einem 4 bis 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten carbocyclischen Ring kondensiert ist, oder (C₄-C₆)Cycloalkenyl, das an einer Seite des Rings mit einem 4 bis 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten carbocyclischen Ring kondensiert ist,

15

wobei jeder der letztgenannten 4 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Alkylamino, Di[(C₁-C₄)alkyl]-amino, [(C₁-C₄)Alkoxy]-carbonyl, [(C₁-C₄)Haloalkoxy]-carbonyl, (C₃-C₆)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, Phenyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, und Heterocyclyl, das unsubstituiert oder substituiert ist, substituiert ist,

20

bedeutet oder

25 R_H^3 (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₂-C₄)Alkenyloxy, (C₂-C₆)Alkinyloxy oder (C₂-C₄)Haloalkoxy bedeutet und

R_H^4 Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl bedeutet oder

R_H³ und R_H⁴ zusammen mit dem direkt gebundenen N-Atom einen vier- bis achtgliedrigen heterocyclischen Ring, der neben dem N-Atom auch weitere Heteroringatome, vorzugsweise bis zu zwei weitere Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy und (C₁-C₄)Alkylthio substituiert ist, bedeutet.

S16) Wirkstoffe, die vorrangig als Herbizide eingesetzt werden, jedoch auch Safenerwirkung auf Kulturpflanzen aufweisen, z.B.

(2,4-Dichlorphenoxy)essigsäure (2,4-D),

10 (4-Chlorphenoxy)essigsäure,

(R,S)-2-(4-Chlor-o-tolyloxy)propionsäure (Mecoprop),

4-(2,4-Dichlorphenoxy)buttersäure (2,4-DB),

(4-Chlor-o-tolyloxy)essigsäure (MCPA),

4-(4-Chlor-o-tolyloxy)buttersäure,

15 4-(4-Chlorphenoxy)buttersäure,

3,6-Dichlor-2-methoxybenzoesäure (Dicamba),

1-(Ethoxycarbonyl)ethyl-3,6-dichlor-2-methoxybenzoat (Lactidichlor-ethyl).

Bevorzugte Safener sind: Cloquintocet-mexyl, Cyprosulfamid, Fenchlorazol-ethylester, Isoxadifen-ethyl, Mefenpyr-diethyl, Fenclorim, Cumyluron, S4-1 und S4-5, Mecamifen, besonders bevorzugt sind: Cloquintocet-mexyl, Cyprosulfamid, Isoxadifen-ethyl, Mefenpyr-diethyl und Metcamifen.

Aufgrund ihrer herbiziden und pflanzenwachstumsregulatorischen Eigenschaften können die Wirkstoffe auch zur Bekämpfung von Schädlingen in Kulturen von bekannten oder noch zu entwickelnden gentechnisch veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch Resistenzen gegenüber bestimmten Pestiziden, vor allem bestimmten Herbiziden, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z. B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt. Weitere besondere Eigenschaften können in einer Toleranz oder Resistenz gegen abiotische Stressoren z. B. Hitze, Kälte, Trockenheit, Salz und ultraviolette Strahlung liegen.

Bevorzugt ist die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen, z. B. von Getreide wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis, Maniok und Mais oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten.

- 5 Vorzugsweise können die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Herbizide in Nutzpflanzenkulturen eingesetzt werden, welche gegenüber den phytotoxischen Wirkungen der Herbizide resistent sind bzw. gentechnisch resistent gemacht worden sind.

Herkömmliche Wege zur Herstellung neuer Pflanzen, die im Vergleich zu bisher vorkommenden Pflanzen modifizierte Eigenschaften aufweisen, bestehen beispielsweise in klassischen

- 10 Züchtungsverfahren und der Erzeugung von Mutanten. Alternativ können neue Pflanzen mit veränderten Eigenschaften mit Hilfe gentechnischer Verfahren erzeugt werden (siehe z. B. EP 0221044, EP 0131624). Beschrieben wurden beispielsweise in mehreren Fällen

- gentechnische Veränderungen von Kulturpflanzen zwecks Modifikation der in den Pflanzen synthetisierten Stärke (z. B. WO 92/011376, WO 92/014827, WO 91/019806),
- 15 - transgene Kulturpflanzen, welche gegen bestimmte Herbizide vom Typ Glufosinate (vgl. z. B. EP 0242236, EP 0242246) oder Glyphosate (WO 92/000377) oder der Sulfonylharnstoffe (EP 0257993, US 5013659) resistent sind,
- transgene Kulturpflanzen, beispielsweise Baumwolle, mit der Fähigkeit *Bacillus thuringiensis*-Toxine (Bt-Toxine) zu produzieren, welche die Pflanzen gegen bestimmte Schädlinge resistent
- 20 machen (EP 0142924, EP 0193259),
- transgene Kulturpflanzen mit modifizierter Fettsäurezusammensetzung (WO 91/013972),
- gentechnisch veränderte Kulturpflanzen mit neuen Inhalts- oder Sekundärstoffen z. B. neuen Phytoalexinen, die eine erhöhte Krankheitsresistenz verursachen (EP 0309862, EP 0464461),
- gentechnisch veränderte Pflanzen mit reduzierter Photorespiration, die höhere Erträge und
- 25 höhere Stresstoleranz aufweisen (EP 0305398),
- transgene Kulturpflanzen, die pharmazeutisch oder diagnostisch wichtige Proteine produzieren („molecular pharming“),
- transgene Kulturpflanzen, die sich durch höhere Erträge oder bessere Qualität auszeichnen
- transgene Kulturpflanzen die sich durch eine Kombinationen z. B. der o. g. neuen Eigenschaften
- 30 auszeichnen („gene stacking“).

Zahlreiche molekularbiologische Techniken, mit denen neue transgene Pflanzen mit veränderten Eigenschaften hergestellt werden können, sind im Prinzip bekannt; siehe z. B. I. Potrykus und G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg oder Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

- 5 Für derartige gentechnische Manipulationen können Nucleinsäuremoleküle in Plasmide eingebracht werden, die eine Mutagenese oder eine Sequenzveränderung durch Rekombination von DNA-Sequenzen erlauben. Mit Hilfe von Standardverfahren können z. B. Basenaustausche vorgenommen, Teilsequenzen entfernt oder natürliche oder synthetische Sequenzen hinzugefügt werden. Für die Verbindung der DNA-Fragmente untereinander können an die Fragmente Adaptoren oder Linker
- 10 angesetzt werden, siehe z. B. Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2. Aufl. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; oder Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2. Auflage 1996.

Die Herstellung von Pflanzenzellen mit einer verringerten Aktivität eines Genprodukts kann beispielsweise erzielt werden durch die Expression mindestens einer entsprechenden antisense-RNA,

15 einer sense-RNA zur Erzielung eines Cosuppressionseffektes oder die Expression mindestens eines entsprechend konstruierten Ribozyms, das spezifisch Transkripte des obengenannten Genprodukts spaltet.

Hierzu können zum einen DNA-Moleküle verwendet werden, die die gesamte codierende Sequenz eines Genprodukts einschließlich eventuell vorhandener flankierender Sequenzen umfassen, als auch DNA-

20 Moleküle, die nur Teile der codierenden Sequenz umfassen, wobei diese Teile lang genug sein müssen, um in den Zellen einen antisense-Effekt zu bewirken. Möglich ist auch die Verwendung von DNA-Sequenzen, die einen hohen Grad an Homologie zu den codierten Sequenzen eines Genprodukts aufweisen, aber nicht vollkommen identisch sind.

Bei der Expression von Nucleinsäuremolekülen in Pflanzen kann das synthetisierte Protein in jedem

25 beliebigen Kompartiment der pflanzlichen Zelle lokalisiert sein. Um aber die Lokalisation in einem bestimmten Kompartiment zu erreichen, kann z. B. die codierende Region mit DNA-Sequenzen verknüpft werden, die die Lokalisierung in einem bestimmten Kompartiment gewährleisten. Derartige Sequenzen sind dem Fachmann bekannt (siehe beispielsweise Braun et al., *EMBO J.* 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., *Plant J.* 1 (1991),

30 95-106). Die Expression der Nucleinsäuremoleküle kann auch in den Organellen der Pflanzenzellen stattfinden.

Die transgenen Pflanzenzellen können nach bekannten Techniken zu ganzen Pflanzen regeneriert werden. Bei den transgenen Pflanzen kann es sich prinzipiell um Pflanzen jeder beliebigen Pflanzenspezies handeln, d.h., sowohl monokotyle als auch dikotyle Pflanzen.

So sind transgene Pflanzen erhältlich, die veränderte Eigenschaften durch Überexpression, Suppression oder Inhibierung homologer (= natürlicher) Gene oder Gensequenzen oder Expression heterologer (= fremder) Gene oder Gensequenzen aufweisen.

- Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) in transgenen Kulturen eingesetzt werden, welche gegen Wachstumsstoffe, wie z. B. Dicamba oder gegen Herbizide, die essentielle Pflanzenenzyme, z. B. Acetolactatsynthasen (ALS), EPSP Synthasen, Glutaminsynthasen (GS) oder Hydroxyphenylpyruvat Dioxygenasen (HPPD) hemmen, respektive gegen Herbizide aus der Gruppe der Sulfonylharnstoffe, der Glyphosate, Glufosinate oder Benzoylisoxazole und analogen Wirkstoffe, resistent sind.
- Bei der Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe der allgemeinen Formel (I) in transgenen Kulturen treten neben den in anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schädlingen oftmals Wirkungen auf, die für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, beispielsweise ein verändertes oder speziell erweitertes Unkrautspektrum, das bekämpft werden kann, veränderte Aufwandmengen, die für die Applikation eingesetzt werden können, vorzugsweise gute Kombinierbarkeit mit den Herbiziden, gegenüber denen die transgene Kultur resistent ist, sowie Beeinflussung von Wuchs und Ertrag der transgenen Kulturpflanzen.

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Herbizide zur Bekämpfung von Schädlingen in transgenen Kulturpflanzen.

- Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem welche biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben sind. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen beispielsweise in Frage: Spritzpulver (WP), wasserlösliche Pulver (SP), wasserlösliche Konzentrate, emulgierbare Konzentrate (EC), Emulsionen (EW), wie Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, versprühbare Lösungen, Suspensionskonzentrate (SC), Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis, ölmischbare Lösungen, Kapselsuspensionen (CS), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate für die Streu- und Bodenapplikation, Granulate (GR) in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln und Wachse.

- Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösemittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of

Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z. B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden, Fungiziden, sowie mit Safenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z. B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Tenside ionischer und/oder nichtionischer Art (Netzmittel, Dispergiermittel), z. B. polyoxyethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, polyoxethylierte Fettamine, Fettalkoholpolyglykolethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-Dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutyl-naphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleoilylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Zur Herstellung der Spritzpulver werden die herbiziden Wirkstoffe beispielsweise in üblichen Apparaturen wie Hammermühlen, Gebläsemühlen und Luftstrahlmühlen feingemahlen und gleichzeitig oder anschließend mit den Formulierungshilfsmitteln vermischt.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösemittel z. B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösemittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester wie z. B. Sorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitanester wie z. B. Polyoxyethylensorbitanfettsäureester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, oder Diatomeenerde.

Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z. B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden.

Emulsionen, z.B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rühren, Kolloidmühlen und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wäßrigen organischen Lösemitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen.

- 5 Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise – gewünschtenfalls in
- 10 Mischung mit Düngemitteln – granuliert werden.

Wasserdispergierbare Granulate werden in der Regel nach den üblichen Verfahren wie Sprühtrocknung, Wirbelbett-Granulierung, Teller-Granulierung, Mischung mit Hochgeschwindigkeitsmischern und Extrusion ohne festes Inertmaterial hergestellt.

- Zur Herstellung von Teller-, Fließbett-, Extruder- und Sprühgranulate siehe z. B. Verfahren in "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, Seiten 147 ff; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, S. 8-57.
- 15

- Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z. B. G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Seiten 81-96 und J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, Seiten 101-103.
- 20

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 95 Gew.-%, Wirkstoff der Formel (I).

- In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z. B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten 1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0,05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-% Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe u.a. verwendet werden.
- 25
- 30 Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Konservierungs-, Frostschutz- und Lösemittel, Füll-, Träger- und Farbstoffe, Entschäumer, Verdunstungshemmer und den pH-Wert und die Viskosität beeinflussende Mittel.

- 5 Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze können als solche oder in Form ihrer Zubereitungen (Formulierungen) mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z. B. Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Herbiziden, Fungiziden, Safenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren kombiniert eingesetzt werden, z. B. als Fertigformulierung oder als Tankmischungen.
- 10 Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z. B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.
- 15 Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der Verbindungen der Formel (I) und deren Salze. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,001 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,005 bis 5 kg/ha, weiter bevorzugt im Bereich von 0,01 bis 1,5 kg/ha, insbesondere bevorzugt im Bereich von 0,05 bis 1 kg/ha g/ha. Dies gilt sowohl für die
- 20 Anwendung im Voraufbau oder im Nachaufbau.

Die vorliegende Erfindung wird anhand der nachfolgenden Beispiele näher erläutert, welche die Erfindung jedoch keinesfalls beschränken.

25 A. Synthesebeispiele

1-(2-{{(1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl}amino}-4-methylpyrimidin-5-yl)ethanol (Bspl. 1.7)

1. Zu einer Lösung von 0.750g (4.115 mmol) 1-[4-Methyl-2-(methylsulfanyl)pyrimidin-5-yl]ethanon in 35 ml Trichlormethan tropfte man bei 0°C 1.946 g (8.231 mmol) meta-Chlorperbenzoesäure gelöst in 40 ml Trichlormethan. Man rührte 1h bei 20°C und gab nacheinander 2.290 g (22.634 mmol) Triethylamin und 0,730 g (4.527 mmol (1R,2S)-2,6-Dimethylindan-1-amin gelöst in 10 ml Trichlormethan zu. Man rührte 1.5h bei 50°C, versetzte das Gemisch mit Wasser und
- 30

- Dichlormethan und extrahierte die wässrige Phase zweimal mit Dichlormethan. Nach Trocknen der vereinigten organischen Phase über Natriumsulfat, entfernte man das Lösungsmittel im Vakuum und nahm den Rückstand in Acetonitril auf. Nach Filtration vom unlöslichen Rückstand (3-Chlorbenzoesäure) entfernte man das Lösungsmittel im Vakuum und erhielt nach Reinigung des
- 5 Rückstands durch Chromatographie [Start: Ethylacetat/n-Heptan (5 : 95), innerhalb von 25 min auf Ethylacetat/n-Heptan (30 : 70)] 0.853g (70%) 1-(2-{{[(1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]amino}}-4-methylpyrimidin-5-yl)ethanon.
2. Zu einer Lösung von 0.850g (2.878mmol) 1-(2-{{[(1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]amino}}-4-methylpyrimidin-5-yl)ethanon in 10 ml Ethanol gab man portionsweise 0.327g (8.633
- 10 mmol) Natriumtetrahydroborat und rührte 2h bei 0°C. Man säuerte das Reaktionsgemisch mit 2 M Salzsäure an und entfernte das Lösungsmittel im Vakuum. Den Rückstand versetzte man mit Dichlormethan und Wasser, gab wässrige Natriumcarbonat-Lösung zu, rührte 5 min bei 20°C und extrahierte die wässrige Phase zweimal mit Dichlormethan. Nach Trocknen der vereinigten organischen Phase über Natriumsulfat, entfernte man das Lösungsmittel im Vakuum und erhielt
- 15 nach Reinigung des Rückstands durch Chromatographie [Start: Ethylacetat/n-Heptan (5 : 95), innerhalb von 15 min auf Ethylacetat/n-Heptan (35 : 65)] 0.715g (84%) 1-(2-{{[(1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]amino}}-4-methylpyrimidin-5-yl)ethanol (Bspl. 1.7)
- 2-{2-[(1R)-1,2,3,4-Tetrahydronaphthalin-1-ylamino]pyrimidin-5-yl}propan-2-ol (Bspl. 1.8)
- 20 1. Zu einer Lösung von 2.200g (11.097 mmol) Ethyl-2-(methylsulfanyl)pyrimidin-5-carboxylat in 30 ml Trichlormethan tropfte man bei 0°C 4.309 g (24.969 mmol) meta-Chlorperbenzoesäure gelöst in 35 ml Trichlormethan. Man rührte 0.5h bei 0-5°C und gab nacheinander 11.474 g (88.779 mmol) N,N-Diisopropylethylamin und 1.634 g (11.097 mmol) (1R)-1,2,3,4-Tetrahydronaphthalin-1-amin gelöst in 10 ml Trichlormethan zu. Man rührte 4h bei 40°C, versetzte das Gemisch mit Wasser und
- 25 Dichlormethan und extrahierte die wässrige Phase zweimal mit Dichlormethan. Nach Trocknen der vereinigten organischen Phase über Natriumsulfat, entfernte man das Lösungsmittel im Vakuum und nahm den Rückstand in Acetonitril auf. Nach Filtration vom unlöslichen Rückstand (3-Chlorbenzoesäure) entfernte man das Lösungsmittel im Vakuum und erhielt 2.763g (84%) Ethyl-2-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalin-1-ylamino]pyrimidin-5-carboxylat, das ohne weitere Reinigung
- 30 weiter umgesetzt wurde.
2. Zu einer Lösung von 0.500g (1.682 mmol) Ethyl-2-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalin-1-ylamino]pyrimidin-5-carboxylat in 7.5 ml trockenem Tetrahydrofuran gab man bei 0°C 2,396 ml (4,792 mmol) Methylmagnesiumbromid (2 molare Lösung in 2-Methyltetrahydrofuran) und rührte

5h bei 55°C unter Stickstoffatmosphäre. Man tropfte zum auf 0°C abgekühltem Reaktionsgemisch ca. 30 ml eines Lösemittelgemischs aus THF / Wasser (4 : 1) und extarhierte dreimal mit Ethylacetat. Nach Trocknen der vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat destillierte man das Lösungsmittel im Vakuum und erhielt nach Reinigung des Rückstands durch Chromatographie [Start: Ethylacetat/n-Heptan (5 : 95), innerhalb von 25 min auf Ethylacetat/n-Heptan (65 : 35)] 0.122 g (26%) 2-(2-[(1R)-1,2,3,4-Tetrahydronaphthalin-1-ylamino]pyrimidin-5-yl)propan-2-ol (Bspl. 1.8).

2-(2-[(1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]amino}pyrimidin-5-yl)but-3-en-2-ol (Bspl. 1.15)

1. Ein Gemisch aus 1.000g (6.387 mmol) 1-(2-Chlorpyrimidin-5-yl)ethanon, 1.236g (7.664 mmol) (1R,2S)-2,6-Dimethylindan-1-amin und 2.476 g (19.161 mmol) N,N-Diisopropylethylamin in 8,0 ml 1,4-Dioxan wurde in einem Mikrowellenofen 45 min bei 140°C erhitzt. Nach Entfernen des Lösemittels im Vakuum versetzte man das Gemisch mit Wasser und Dichlormethan und extrahierte die wässrige Phase zweimal mit Dichlormethan. Nach Trocknen der vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat destillierte man das Lösungsmittel im Vakuum und erhielt nach Reinigung des Rückstands durch Chromatographie [Start: Ethylacetat/n-Heptan (5 : 95), innerhalb von 25 min auf Ethylacetat/n-Heptan (50 : 50)] 1.630 g (85%) 1-(2-[(1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]amino}pyrimidin-5-yl)ethanon.

2. Zu einer Lösung von 1.617 ml (1.617 mmol) Brom(vinyl)magnesium (1 molare Lösung in Tetrahydrofuran) gab man bei 0°C 0.260g (0.924 mmol) 1-(2-[(1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]amino}pyrimidin-5-yl)ethanon in 4.5 ml trockenem Tetrahydrofuran und rührte 1.5h bei 20°C unter Stickstoffatmosphäre. Man tropfte zum Gemisch gesättigte wässrige Ammoniumchlorid-Lösung und extarhierte die wässrige Phase dreimal mit Ethylacetat. Nach Trocknen der vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat destillierte man das Lösungsmittel im Vakuum und erhielt nach Reinigung des Rückstands durch Chromatographie [Start: Ethylacetat/n-Heptan (5 : 95), innerhalb von 30 min auf Ethylacetat/n-Heptan (50 : 50)] 0.066 g (23%) 2-(2-[(1R,2S)-2,6-Dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl]amino}pyrimidin-5-yl)but-3-en-2-ol (Bspl. 1.15).

NMR-Daten ausgewählter Beispiele

NMR-Peak-Listenverfahren

Die ^1H -NMR-Daten ausgewählter Beispiele werden in Form von ^1H -NMR-Peaklisten notiert. Zu jedem Signalpeak wird erst der δ -Wert in ppm und dann die Signalintensität in runden Klammern aufgeführt.

- 5 Die δ -Wert – Signalintensitäts- Zahlenpaare von verschiedenen Signalpeaks werden durch Semikolons voneinander getrennt aufgelistet.

Die Peakliste eines Beispiels hat daher die Form:

δ_1 (Intensität₁); δ_2 (Intensität₂);; δ_i (Intensität_i);; δ_n (Intensität_n)

- 10 Die Intensität scharfer Signale korreliert mit der Höhe der Signale in einem gedruckten Beispiel eines NMR-Spektrums in cm und zeigt die wirklichen Verhältnisse der Signalintensitäten. Bei breiten Signalen können mehrere Peaks oder die Mitte des Signals und ihre relative Intensität im Vergleich zum intensivsten Signal im Spektrum gezeigt werden.

- 15 Zur Kalibrierung der chemischen Verschiebung von ^1H -NMR-Spektren benutzen wir Tetramethylsilan und/oder die chemische Verschiebung des Lösungsmittels, besonders im Falle von Spektren, die in DMSO gemessen werden. Daher kann in NMR-Peaklisten der Tetramethylsilan-Peak vorkommen, muss es aber nicht.

Die Listen der ^1H -NMR-Peaks sind ähnlich den klassischen ^1H -NMR-Ausdrücken und enthalten somit gewöhnlich alle Peaks, die bei einer klassischen NMR-Interpretation aufgeführt werden.

- 20 Darüber hinaus können sie wie klassische ^1H -NMR-Ausdrücke Lösungsmittelsignale, Signale von Stereoisomeren der Zielverbindungen, die ebenfalls Gegenstand der Erfindung sind, und/oder Peaks von Verunreinigungen zeigen.

- Bei der Angabe von Verbindungssignalen im Delta-Bereich von Lösungsmitteln und/oder Wasser sind in unseren Listen von ^1H -NMR-Peaks die gewöhnlichen Lösungsmittelpeaks, zum Beispiel Peaks von DMSO in DMSO- D_6 und der Peak von Wasser, gezeigt, die gewöhnlich im Durchschnitt eine hohe
25 Intensität aufweisen.

Die Peaks von Stereoisomeren der Targetverbindungen und/oder Peaks von Verunreinigungen haben gewöhnlich im Durchschnitt eine geringere Intensität als die Peaks der Zielverbindungen (zum Beispiel mit einer Reinheit von $>90\%$).

Solche Stereoisomere und/oder Verunreinigungen können typisch für das jeweilige Herstellungsverfahren sein. Ihre Peaks können somit dabei helfen, die Reproduktion unseres Herstellungsverfahrens anhand von "Nebenprodukt-Fingerabdrücken" zu erkennen.

- 5 Einem Experten, der die Peaks der Zielverbindungen mit bekannten Verfahren (MestreC, ACD-Simulation, aber auch mit empirisch ausgewerteten Erwartungswerten) berechnet, kann je nach Bedarf die Peaks der Zielverbindungen isolieren, wobei gegebenenfalls zusätzliche Intensitätsfilter eingesetzt werden. Diese Isolierung wäre ähnlich dem betreffenden Peak-Picking bei der klassischen ¹H-NMR-Interpretation.

- 10 Weitere Details zu ¹H-NMR-Peaklisten können der Research Disclosure Database Number 564025 entnommen werden.

<p>1.2: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3259 (7.5); 8.0913 (0.8); 7.2590 (38.3); 7.0974 (1.9); 7.0785 (2.9); 7.0259 (7.1); 7.0071 (1.5); 5.4527 (0.9); 5.4308 (1.0); 5.2635 (1.3); 5.2415 (2.2); 5.2193 (1.0); 4.8503 (0.9); 4.8342 (2.8); 4.8180 (2.8); 4.8018 (0.9); 4.1470 (0.9); 4.1291 (2.8); 4.1113 (2.8); 4.0934 (0.9); 3.0769 (1.2); 3.0576 (1.3); 3.0383 (1.4); 3.0191 (1.5); 2.5584 (1.0); 2.5351 (1.2); 2.5198 (0.9); 2.4968 (1.1); 2.3328 (0.8); 2.3183 (0.9); 2.2893 (16.0); 2.2612 (1.0); 2.2387 (0.6); 2.0419 (12.4); 1.5489 (11.7); 1.5327 (11.5); 1.2872 (10.7); 1.2753 (4.8); 1.2704 (10.5); 1.2575 (7.1); 1.2396 (3.4); 0.0079 (0.6); -0.0002 (15.5); -0.0084 (0.6)</p>
<p>1.3: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.2899 (10.0); 7.5168 (0.6); 7.3084 (3.1); 7.2947 (3.7); 7.2876 (4.2); 7.2795 (2.3); 7.2740 (4.0); 7.2580 (99.0); 7.1056 (2.5); 7.0869 (4.1); 7.0501 (7.3); 7.0343 (4.6); 7.0287 (8.3); 7.0122 (2.7); 7.0069 (3.6); 6.9940 (0.8); 5.3378 (0.8); 5.3161 (1.2); 5.2713 (1.8); 5.2504 (2.4); 5.2284 (1.0); 4.4600 (1.3); 4.4552 (1.3); 4.4308 (2.4); 4.4264 (2.4); 4.4118 (1.1); 4.3957 (3.3); 4.3794 (3.4); 4.3612 (3.8); 4.3312 (1.9); 3.0883 (1.4); 3.0691 (1.5); 3.0495 (1.6); 3.0305 (1.6); 2.5667 (1.1); 2.5441 (1.4); 2.5273 (1.0); 2.5051 (1.2); 2.3298 (0.8); 2.2973 (16.0); 2.2733 (1.2); 2.2536 (0.6); 1.5292 (10.6); 1.5277 (10.6); 1.5129 (10.5); 1.5114 (10.3); 1.3039 (8.9); 1.2984 (9.2); 1.2871 (8.8); 1.2816 (8.8); 1.2584 (1.0); 1.2470 (0.5); 0.0080 (1.3); -0.0002 (40.0); -0.0084 (1.4)</p>
<p>1.4: ¹H-NMR(400.6 MHz, CDCl₃): δ= 8.4064 (5.1); 7.2606 (6.4); 7.0995 (1.8); 7.0807 (3.0); 7.0363 (3.7); 7.0262 (2.6); 7.0073 (1.4); 5.4388 (1.0); 5.4161 (1.2); 5.2591 (1.3); 5.2372 (2.1); 5.2151 (1.0); 3.0742 (1.2); 3.0551 (1.2); 3.0358 (1.4); 3.0167 (1.4); 2.5577 (0.9); 2.5347 (1.1); 2.5196 (0.8); 2.4965 (1.0); 2.3121 (0.6); 2.2902 (16.0); 2.2726 (1.2); 2.2552 (0.8); 1.7440 (1.1); 1.5875 (54.2); 1.2885 (12.2); 1.2717 (11.8); -0.0002 (1.8)</p>
<p>1.5: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4426 (2.2); 7.2594 (24.2); 7.1537 (0.7); 7.1483 (0.8); 7.1379 (0.7); 7.0637 (0.5); 2.3232 (3.7); 1.6676 (1.6); 1.5934 (16.0); 1.5707 (0.8); -0.0002 (9.0)</p>
<p>1.6: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.2917 (1.5); 7.2593 (25.4); 7.0903 (0.8); 7.0713 (1.3); 7.0408 (1.5); 7.0174 (1.0); 6.9953 (0.7); 5.2488 (0.6); 3.0664 (0.5); 3.0473 (0.5); 3.0279 (0.6); 3.0087 (0.6); 2.6187 (14.9); 2.2879 (6.6); 2.2779 (0.6); 2.2753 (0.6); 2.2547 (0.6); 2.1690 (0.5); 1.6528 (16.0); 1.6080 (2.0); 1.2856 (6.0); 1.2758 (0.6); 1.2688 (6.0); 1.2581 (0.5); -0.0002 (9.8)</p>
<p>1.7: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3239 (1.5); 7.2592 (32.8); 7.0908 (1.0); 7.0720 (1.6); 7.0347 (1.7); 7.0180 (1.3); 6.9955 (0.8); 5.2617 (0.8); 5.2398 (0.5); 5.1639 (0.6); 5.0198 (0.5); 5.0103 (0.6); 5.0040 (0.6); 4.9940 (0.5); 3.0656 (0.6); 3.0463 (0.7); 3.0272 (0.7); 3.0079 (0.8); 2.5531 (0.5); 2.5293 (0.6); 2.4918 (0.5); 2.4155 (16.0); 2.2865 (8.2); 2.2525 (0.6); 1.6811 (1.1); 1.6714 (1.1); 1.5814 (0.6); 1.5475 (7.3); 1.5313 (7.2); 1.2854 (4.1); 1.2823 (4.4); 1.2686 (4.3); 1.2655 (4.6); 0.8817 (0.9); -0.0002 (11.7)</p>

1.8: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4389 (16.0); 7.5181 (2.3); 7.3689 (3.2); 7.3514 (4.0); 7.3469 (3.9); 7.2593 (421.3); 7.2256 (0.8); 7.2085 (0.8); 7.1967 (1.6); 7.1830 (3.3); 7.1785 (3.8); 7.1656 (8.4); 7.1598 (8.6); 7.1468 (3.1); 7.1421 (4.1); 7.1241 (5.2); 7.1026 (2.5); 6.9953 (2.4); 5.3472 (1.7); 5.2770 (2.5); 5.2610 (2.0); 5.2400 (1.0); 2.8819 (0.9); 2.8548 (1.7); 2.8394 (2.8); 2.8173 (1.8); 2.8025 (2.5); 2.7861 (1.6); 2.7580 (0.9); 2.1457 (1.2); 2.1328 (1.2); 2.1225 (1.5); 2.1119 (2.3); 2.1001 (1.5); 2.0863 (1.1); 2.0433 (1.5); 1.9444 (1.4); 1.9227 (2.8); 1.9131 (3.9); 1.8967 (5.4); 1.8816 (5.0); 1.8655 (1.7); 1.6366 (10.2); 1.6188 (1.1); 1.5904 (135.9); 1.5478 (14.0); 1.2766 (0.5); 1.2583 (1.0); 1.2404 (0.6); 0.1461 (0.7); 0.0079 (4.4); -0.0002 (151.6); -0.0085 (5.2); -0.1501 (0.5)
1.9: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.7708 (0.8); 8.4565 (16.0); 7.5180 (3.9); 7.3036 (2.6); 7.2849 (3.3); 7.2591 (698.5); 7.2091 (2.1); 7.1894 (2.3); 7.1702 (1.9); 6.9951 (3.8); 6.9158 (2.1); 6.9127 (2.3); 6.8939 (3.6); 6.8783 (1.7); 6.8753 (1.8); 6.8636 (3.5); 6.8431 (3.2); 5.3984 (0.8); 5.2983 (2.5); 5.2373 (0.9); 5.2243 (1.8); 5.2055 (1.6); 4.2966 (1.9); 4.2887 (1.8); 4.2825 (2.1); 4.2708 (2.8); 4.2627 (2.7); 4.2483 (2.1); 4.2409 (2.6); 4.2199 (0.9); 2.6554 (2.5); 2.5939 (2.5); 2.2976 (1.2); 2.2849 (1.5); 2.2753 (1.4); 2.2624 (1.8); 2.2502 (1.2); 2.2412 (1.0); 2.1859 (1.2); 2.1793 (1.5); 2.1717 (1.7); 2.1573 (1.2); 2.1438 (1.1); 2.1365 (0.9); 1.6336 (14.3); 1.5949 (80.0); 1.5332 (23.3); 1.2564 (0.8); 0.0080 (8.2); -0.0002 (248.6); -0.0085 (7.4); -0.1498 (0.9)
1.10: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3194 (5.5); 7.2591 (39.9); 7.1002 (1.1); 7.0812 (1.8); 7.0500 (2.1); 7.0277 (1.4); 7.0087 (0.8); 5.2657 (0.9); 5.2534 (1.2); 5.2336 (1.1); 3.0808 (0.7); 3.0616 (0.7); 3.0421 (0.8); 3.0230 (0.8); 2.5583 (0.5); 2.5353 (0.6); 2.4975 (0.6); 2.2920 (9.1); 1.8485 (0.8); 1.8420 (1.0); 1.8331 (1.9); 1.8294 (2.1); 1.8236 (3.3); 1.8143 (2.0); 1.8105 (2.1); 1.8052 (3.6); 1.7955 (0.7); 1.7918 (0.8); 1.7871 (1.3); 1.5997 (0.8); 1.5447 (3.4); 1.2940 (8.2); 1.2771 (8.1); 0.8816 (1.2); 0.8766 (7.5); 0.8581 (16.0); 0.8394 (6.8); -0.0002 (14.0)
1.11: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4453 (1.5); 7.2583 (54.3); 7.1059 (1.8); 7.0874 (3.0); 7.0393 (5.5); 7.0187 (1.4); 5.4997 (0.9); 5.4771 (1.1); 5.2767 (1.3); 5.2551 (2.1); 5.2331 (1.0); 3.0880 (1.2); 3.0688 (1.2); 3.0493 (1.4); 3.0302 (1.4); 2.5649 (2.7); 2.5409 (1.2); 2.5253 (0.8); 2.5030 (1.0); 2.3287 (0.5); 2.2985 (16.0); 2.2713 (0.9); 2.0432 (1.3); 1.7721 (12.4); 1.7700 (12.8); 1.5843 (7.2); 1.2903 (10.6); 1.2735 (10.6); 1.2582 (1.5); 0.8818 (1.4); 0.8641 (0.6); 0.0080 (0.6); -0.0002 (18.9); -0.0085 (0.6)
1.12: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2929 (1.0); 7.2587 (8.9); 7.1437 (2.0); 7.1238 (1.0); 7.0480 (0.8); 2.6410 (0.5); 2.6100 (7.8); 2.3129 (5.3); 1.6604 (0.7); 1.6417 (16.0); -0.0002 (3.2)
1.13: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3339 (2.0); 7.2593 (39.4); 7.1423 (2.8); 7.1377 (3.0); 7.1263 (2.5); 7.0518 (1.8); 7.0325 (1.2); 5.5874 (1.0); 5.5677 (1.0); 5.3694 (0.6); 5.0080 (1.4); 4.9919 (1.4); 2.9456 (0.7); 2.9371 (0.7); 2.9235 (0.7); 2.9155 (0.7); 2.8555 (1.0); 2.8355 (0.8); 2.8165 (0.5); 2.6824 (0.7); 2.6739 (0.8); 2.6698 (0.7); 2.6614 (0.6); 2.6509 (0.9); 2.6423 (0.8); 2.4191 (16.0); 2.3136 (12.2); 2.0426 (1.8); 1.8703 (1.0); 1.8681 (0.8); 1.8508 (1.1); 1.8488 (1.1); 1.8388 (1.0); 1.8366 (0.8); 1.8171 (0.9); 1.7497 (0.6); 1.5373 (10.6); 1.5210 (10.6); 1.4317 (1.2); 1.2759 (0.5); 1.2580 (1.2); 1.2401 (0.6); -0.0002 (13.8); -0.0084 (0.6)
1.14: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3714 (9.0); 7.2653 (0.5); 7.2645 (0.6); 7.2588 (57.8); 7.0991 (1.6); 7.0801 (2.7); 7.0430 (3.2); 7.0265 (2.2); 7.0077 (1.2); 5.2971 (1.1); 5.2819 (0.9); 5.2578 (1.5); 5.2372 (1.7); 5.2148 (0.7); 3.0774 (1.0); 3.0583 (1.1); 3.0389 (1.2); 3.0199 (1.3); 2.5585 (0.8); 2.5358 (1.0); 2.5201 (0.7); 2.4972 (0.9); 2.2914 (14.1); 2.2792 (1.0); 2.2763 (1.0); 2.2593 (0.7); 2.2563 (0.7); 1.8505 (1.4); 1.8318 (4.7); 1.8133 (5.2); 1.7948 (1.8); 1.6335 (2.5); 1.5498 (27.3); 1.2926 (10.9); 1.2758 (10.6); 0.9062 (7.1); 0.8877 (16.0); 0.8689 (6.6); 0.0080 (0.7); -0.0002 (23.3); -0.0085 (0.6)
1.15: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3960 (4.1); 7.2588 (33.1); 7.0972 (1.0); 7.0782 (1.6); 7.0313 (2.3); 7.0066 (0.8); 6.1721 (1.4); 6.1456 (1.5); 6.1289 (1.6); 6.1024 (1.6); 5.3624 (2.0); 5.3604 (2.0); 5.3193 (2.1); 5.3173 (2.1); 5.2913 (0.7); 5.2604 (0.9); 5.2391 (1.1); 5.2227 (2.2); 5.2206 (2.2); 5.1962 (2.0); 5.1942 (1.9); 3.0743 (0.7); 3.0551 (0.7); 3.0358 (0.8); 3.0167 (0.8); 2.5568 (0.6); 2.5335 (0.6); 2.4972 (1.0); 2.2906 (9.1); 2.2744 (0.6); 2.2713 (0.7); 1.8499 (3.0); 1.6648 (16.0); 1.2863 (7.6); 1.2695 (7.7); 0.8818 (0.9); -0.0002 (12.5); -0.0084 (0.6)

1.16: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2583 (10.9); 7.0910 (0.6); 7.0393 (0.5); 7.0252 (0.7); 2.2985 (2.9); 1.8975 (4.1); 1.2924 (2.4); 1.2756 (2.4); 0.8819 (0.5); 0.2552 (0.5); 0.2545 (0.5); 0.2470 (16.0); 0.2462 (15.8); 0.2390 (1.0); -0.0002 (3.9)
1.17: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3992 (0.6); 7.2657 (0.8); 7.2649 (0.9); 7.2641 (1.0); 7.2587 (88.9); 7.1005 (1.1); 7.0813 (1.8); 7.0543 (1.0); 7.0329 (1.4); 7.0127 (0.8); 6.9947 (0.5); 3.0900 (0.6); 3.0710 (0.7); 3.0513 (0.7); 3.0320 (0.7); 2.5613 (0.6); 2.5388 (0.7); 2.5004 (0.6); 2.3126 (0.7); 2.2965 (9.4); 2.2738 (0.5); 1.8843 (5.8); 1.6732 (16.0); 1.5391 (5.3); 1.2866 (7.1); 1.2697 (7.1); 0.8820 (0.6); 0.0079 (1.0); -0.0002 (33.4); -0.0085 (1.0)
1.18: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5833 (3.8); 7.5182 (0.9); 7.2698 (0.6); 7.2690 (0.6); 7.2682 (0.8); 7.2674 (0.9); 7.2666 (0.9); 7.2658 (1.1); 7.2650 (1.3); 7.2642 (1.6); 7.2633 (2.1); 7.2593 (147.4); 7.2561 (5.7); 7.2552 (4.5); 7.2544 (3.7); 7.2536 (3.1); 7.2528 (2.7); 7.2520 (2.3); 7.2512 (1.8); 7.2504 (1.6); 7.2496 (1.4); 7.2488 (1.3); 7.2480 (1.3); 7.2472 (1.2); 7.2464 (1.1); 7.2456 (1.0); 7.2448 (1.0); 7.2440 (0.9); 7.2432 (0.9); 7.2424 (0.8); 7.2416 (0.8); 7.2408 (0.8); 7.2400 (0.7); 7.2392 (0.7); 7.2384 (0.6); 7.2376 (0.6); 7.2368 (0.6); 7.2360 (0.6); 7.2352 (0.6); 7.2345 (0.6); 7.2337 (0.5); 7.2256 (0.6); 7.2241 (0.5); 7.2093 (0.6); 7.1029 (0.9); 7.0832 (1.7); 7.0317 (3.9); 7.0131 (0.9); 6.9953 (0.9); 5.2991 (0.7); 5.2789 (1.1); 5.2583 (1.2); 3.0819 (0.7); 3.0628 (0.8); 3.0436 (0.9); 3.0244 (0.9); 2.7281 (8.5); 2.5647 (0.6); 2.5418 (0.7); 2.5030 (0.6); 2.3370 (2.4); 2.2950 (9.1); 2.2619 (0.6); 1.8295 (16.0); 1.5415 (3.6); 1.2938 (6.3); 1.2915 (4.9); 1.2770 (6.5); 1.2747 (4.9); 0.8819 (1.3); 0.0080 (2.1); -0.0002 (79.7); -0.0085 (2.8)
1.19: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4958 (2.2); 7.2581 (32.0); 7.1024 (1.9); 7.0836 (3.2); 7.0448 (2.7); 7.0329 (2.8); 7.0135 (1.5); 5.8380 (0.8); 5.8343 (1.1); 5.8218 (0.8); 5.8180 (1.1); 5.7177 (0.8); 5.7140 (1.1); 5.7015 (0.8); 5.6977 (1.1); 5.3427 (0.7); 5.3214 (0.9); 5.2679 (1.3); 5.2469 (1.9); 5.2252 (0.9); 5.1900 (0.9); 3.0865 (1.2); 3.0673 (1.3); 3.0479 (1.4); 3.0287 (1.4); 2.5563 (1.0); 2.5340 (1.2); 2.5178 (0.9); 2.4955 (1.1); 2.3243 (0.7); 2.3219 (0.7); 2.2962 (16.0); 2.2684 (0.9); 2.2661 (0.8); 1.9444 (0.7); 1.9129 (1.1); 1.7319 (6.5); 1.7299 (4.2); 1.7157 (6.6); 1.7137 (4.2); 1.6705 (6.9); 1.6542 (6.6); 1.5920 (4.4); 1.5767 (5.6); 1.5586 (7.5); 1.5415 (4.1); 1.3039 (0.8); 1.2817 (8.2); 1.2772 (8.7); 1.2648 (10.1); 1.2605 (9.6); 0.8987 (1.5); 0.8817 (5.3); 0.8640 (2.0); -0.0002 (14.1)
1.20: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4658 (5.6); 7.2615 (39.0); 7.1028 (1.8); 7.0839 (3.0); 7.0458 (3.5); 7.0294 (2.4); 7.0105 (1.4); 7.0089 (1.4); 5.3335 (0.8); 5.3105 (1.4); 5.2616 (1.5); 5.2400 (2.0); 5.2177 (0.8); 3.0764 (1.2); 3.0573 (1.2); 3.0380 (1.4); 3.0189 (1.4); 2.5619 (0.9); 2.5387 (1.1); 2.5236 (0.8); 2.5004 (1.0); 2.3158 (0.5); 2.2940 (16.0); 2.2761 (1.3); 2.2590 (0.8); 2.2561 (0.7); 2.0471 (1.8); 1.5631 (3.0); 1.5052 (26.4); 1.2956 (14.5); 1.2788 (14.8); 1.2636 (5.0); 1.2602 (4.9); 1.2501 (2.3); 1.2426 (2.2); 1.2365 (1.2); 1.2290 (2.5); 1.2231 (0.9); 1.2155 (1.5); 1.2083 (1.5); 1.1946 (0.8); 0.8985 (2.4); 0.8816 (8.2); 0.8639 (3.2); 0.5906 (0.5); 0.5776 (0.6); 0.5739 (1.6); 0.5686 (2.1); 0.5632 (0.6); 0.5542 (0.8); 0.5524 (0.8); 0.5472 (1.8); 0.5435 (0.6); 0.5341 (2.2); 0.5133 (2.1); 0.5073 (1.0); 0.4874 (1.5); 0.4725 (0.7); 0.4659 (1.0); 0.4643 (1.0); 0.4576 (3.8); 0.4505 (1.5); 0.4486 (1.6); 0.4440 (3.8); 0.4335 (1.2); 0.4321 (1.3); 0.0079 (0.6); -0.0002 (21.5); -0.0085 (0.8)
1.21: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3376 (2.5); 7.5178 (0.6); 7.4794 (2.0); 7.4758 (2.8); 7.4707 (0.9); 7.4609 (1.5); 7.4581 (3.2); 7.4562 (2.8); 7.4550 (3.0); 7.4498 (0.6); 7.3954 (0.5); 7.3931 (1.2); 7.3911 (1.9); 7.3864 (0.7); 7.3783 (0.6); 7.3730 (3.5); 7.3692 (1.8); 7.3574 (1.0); 7.3535 (1.8); 7.3104 (0.8); 7.3071 (1.6); 7.3037 (0.9); 7.2942 (0.7); 7.2887 (1.6); 7.2834 (0.5); 7.2739 (0.5); 7.2707 (0.9); 7.2673 (0.7); 7.2588 (112.3); 7.0915 (0.9); 7.0725 (1.6); 7.0232 (3.7); 7.0044 (0.8); 6.9949 (0.7); 5.2450 (0.7); 5.2233 (1.1); 5.2013 (0.6); 3.0742 (0.6); 3.0550 (0.7); 3.0359 (0.8); 3.0165 (0.8); 2.5465 (0.5); 2.5237 (0.6); 2.4859 (0.6); 2.2883 (8.7); 2.1441 (4.5); 1.9603 (16.0); 1.2730 (8.7); 1.2562 (8.4); 0.8818 (1.3); 0.0079 (1.5); -0.0002 (49.1); -0.0069 (0.7); -0.0085 (1.5)
1.22: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5843 (1.0); 7.2594 (64.8); 7.1022 (0.7); 7.0820 (1.2); 7.0303 (2.6); 7.0133 (0.7); 5.2659 (0.9); 3.0689 (0.5); 3.0494 (0.6); 3.0303 (0.6); 2.3124 (0.6); 2.2945 (6.1); 2.2675 (1.3); 1.9191 (16.0); 1.7767 (9.9); 1.2932 (3.3); 1.2899 (3.5); 1.2764 (3.4); 1.2731 (3.6); 1.2622 (0.7); 0.8819 (1.0); 0.0080 (0.8); -0.0002 (28.0); -0.0085 (0.9)

1.23: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3192 (0.8); 7.2583 (16.9); 7.0997 (0.8); 7.0804 (1.6); 7.0527 (0.8); 7.0269 (0.9); 7.0081 (0.5); 3.0882 (0.5); 3.0690 (0.6); 3.0496 (0.6); 3.0305 (0.6); 2.3131 (0.5); 2.3012 (3.8); 2.2888 (3.8); 1.7130 (1.8); 1.7097 (1.9); 1.6974 (2.2); 1.6941 (2.0); 1.6695 (16.0); 1.6519 (2.1); 1.6486 (2.1); 1.6362 (1.8); 1.6329 (1.9); 1.2985 (3.4); 1.2812 (5.4); 1.2636 (4.0); 0.8987 (0.6); 0.8818 (2.0); 0.8641 (0.7); -0.0002 (9.8)
1.24: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3418 (4.4); 7.2590 (16.5); 7.1027 (0.8); 7.0838 (1.3); 7.0491 (1.5); 7.0307 (1.0); 7.0116 (0.6); 5.2640 (0.7); 5.2429 (0.9); 3.1205 (16.0); 3.0829 (0.5); 3.0639 (0.6); 3.0445 (0.6); 3.0253 (0.6); 2.2944 (6.8); 1.5281 (22.8); 1.2967 (6.1); 1.2799 (5.9); -0.0002 (8.8)
1.25: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3854 (6.3); 7.5179 (0.5); 7.2688 (0.6); 7.2681 (0.6); 7.2590 (95.9); 7.0996 (2.1); 7.0806 (3.2); 7.0329 (4.1); 7.0297 (4.1); 7.0085 (1.6); 6.9950 (0.6); 5.4067 (0.5); 5.2654 (1.3); 5.2436 (2.2); 5.2218 (1.0); 3.0824 (1.3); 3.0633 (1.4); 3.0440 (1.5); 3.0249 (1.6); 2.5965 (0.6); 2.5936 (0.6); 2.5597 (1.1); 2.5369 (1.2); 2.5218 (0.9); 2.4985 (2.4); 2.3287 (0.6); 2.3225 (0.6); 2.3063 (1.8); 2.2882 (16.0); 2.2721 (1.0); 1.7697 (0.9); 1.7655 (0.6); 1.7495 (1.6); 1.7279 (4.3); 1.7219 (2.0); 1.7139 (3.4); 1.7097 (1.7); 1.7026 (0.8); 1.6936 (1.5); 1.6892 (2.0); 1.6855 (1.3); 1.6810 (1.2); 1.6739 (1.0); 1.6582 (0.7); 1.5957 (8.7); 1.5658 (24.8); 1.3113 (0.7); 1.3040 (1.0); 1.2929 (12.2); 1.2761 (12.1); 0.9444 (9.5); 0.9290 (9.0); 0.9147 (0.5); 0.8893 (10.7); 0.8818 (4.5); 0.8737 (8.9); 0.8642 (1.7); 0.0080 (1.3); 0.0056 (0.5); -0.0002 (40.4); -0.0066 (0.6); -0.0084 (1.3)
1.26: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3208 (5.9); 7.5173 (1.0); 7.3207 (1.1); 7.3143 (1.5); 7.3102 (1.0); 7.2988 (4.8); 7.2950 (2.4); 7.2848 (2.8); 7.2807 (6.6); 7.2753 (4.8); 7.2712 (3.1); 7.2585 (187.5); 7.2406 (0.7); 7.2088 (0.8); 7.1146 (3.9); 7.1102 (4.2); 7.0952 (4.1); 7.0825 (3.3); 7.0309 (7.2); 7.0140 (1.6); 6.9944 (1.0); 5.2704 (1.3); 5.2484 (2.2); 5.2262 (1.1); 3.1007 (0.9); 3.0943 (0.9); 3.0858 (1.4); 3.0672 (4.0); 3.0610 (3.0); 3.0476 (1.7); 3.0352 (5.3); 3.0287 (2.0); 3.0018 (1.7); 2.5617 (1.0); 2.5405 (1.2); 2.5244 (0.9); 2.5004 (1.0); 2.3308 (0.7); 2.3035 (16.0); 2.2780 (0.8); 1.8251 (5.7); 1.8233 (5.6); 1.5628 (18.2); 1.2916 (10.1); 1.2760 (10.1); 0.8983 (0.5); 0.8819 (1.8); 0.8644 (0.7); 0.0080 (2.2); -0.0002 (76.9); -0.0085 (2.4)
1.27: ¹ H-NMR(599.8 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3419 (4.5); 7.2576 (7.9); 7.0903 (7.2); 7.0777 (10.1); 7.0460 (11.0); 7.0342 (1.7); 7.0180 (8.1); 7.0052 (5.8); 5.6776 (0.5); 5.6621 (0.9); 5.6386 (9.2); 5.5846 (2.8); 5.5698 (4.0); 5.5560 (1.6); 5.2463 (4.2); 5.2318 (7.5); 5.2172 (3.9); 4.9608 (1.5); 4.9582 (2.1); 4.9555 (1.6); 4.7597 (1.9); 3.0594 (4.0); 3.0466 (4.3); 3.0338 (4.6); 3.0210 (4.6); 2.5497 (0.8); 2.5398 (3.6); 2.5251 (4.4); 2.5140 (3.3); 2.4989 (3.6); 2.4821 (2.4); 2.4596 (1.2); 2.3889 (0.3); 2.3193 (1.2); 2.3092 (0.6); 2.2973 (2.1); 2.2852 (50.0); 2.2714 (4.8); 2.2589 (3.2); 2.2451 (1.5); 2.2336 (0.6); 2.1784 (0.4); 2.1050 (0.4); 2.0674 (1.4); 2.0273 (0.6); 1.8556 (0.3); 1.7539 (37.1); 1.7523 (38.0); 1.7367 (0.8); 1.7106 (0.4); 1.7013 (0.5); 1.6449 (0.6); 1.6328 (6.9); 1.6224 (0.6); 1.6070 (40.7); 1.5967 (44.6); 1.5880 (2.4); 1.5819 (1.5); 1.5780 (1.2); 1.5413 (7.8); 1.5388 (8.1); 1.5202 (0.4); 1.5000 (0.4); 1.4889 (0.4); 1.3120 (0.6); 1.3004 (1.1); 1.2807 (27.5); 1.2695 (28.2); 1.2629 (8.0); 1.2196 (0.3); 1.1751 (0.4); 1.1522 (0.3); 1.0008 (0.5); 0.9681 (0.4); 0.9050 (0.8); 0.8930 (3.5); 0.8815 (6.8); 0.8695 (3.4); -0.0001 (1.6)
1.28: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3562 (6.0); 7.2584 (35.2); 7.1006 (1.9); 7.0817 (3.1); 7.0465 (3.6); 7.0285 (2.4); 7.0095 (1.4); 7.0080 (1.4); 5.8705 (0.5); 5.8543 (1.1); 5.8451 (0.6); 5.8380 (0.6); 5.8286 (1.5); 5.8117 (1.6); 5.8022 (0.6); 5.7951 (0.6); 5.7860 (1.3); 5.7697 (0.6); 5.3736 (0.8); 5.3511 (1.1); 5.2597 (1.4); 5.2381 (2.1); 5.2160 (1.0); 5.0544 (0.8); 5.0503 (2.2); 5.0460 (2.3); 5.0419 (1.0); 5.0115 (0.7); 5.0074 (2.0); 5.0031 (2.1); 4.9990 (0.9); 4.9875 (0.9); 4.9844 (2.1); 4.9801 (1.9); 4.9768 (0.9); 4.9621 (0.9); 4.9589 (2.0); 4.9546 (1.8); 4.9514 (0.8); 3.0792 (1.2); 3.0601 (1.3); 3.0407 (1.4); 3.0216 (1.4); 2.5586 (1.0); 2.5361 (1.1); 2.5205 (0.8); 2.4977 (1.0); 2.3181 (0.6); 2.2924 (16.0); 2.2821 (1.4); 2.2786 (1.4); 2.2613 (0.9); 2.2590 (0.8); 2.1342 (0.7); 2.1314 (0.6); 2.1170 (0.9); 2.1136 (1.1); 2.0966 (1.2); 2.0931 (1.2); 2.0761 (1.1); 2.0732 (1.2); 2.0568 (1.0); 2.0536 (1.0); 2.0423 (0.7); 2.0357 (0.7); 1.9059 (4.0); 1.8849 (4.3); 1.8643 (1.8); 1.7589 (5.4); 1.5692 (23.9); 1.5350 (0.5); 1.2928 (13.2); 1.2760 (13.3); 1.2684 (2.4); 1.2655 (2.4); 0.8987 (1.1); 0.8818 (3.8); 0.8641 (1.5); -0.0002 (13.3)

<p>1.30: ¹H-NMR(400.6 MHz, CDCl₃): δ= 8.4470 (16.0); 7.5189 (0.6); 7.3510 (2.6); 7.3498 (2.6); 7.3326 (3.6); 7.2830 (0.7); 7.2806 (0.8); 7.2766 (1.3); 7.2759 (1.3); 7.2711 (0.6); 7.2702 (0.6); 7.2694 (0.8); 7.2604 (107.4); 7.2485 (0.8); 7.2451 (4.1); 7.2438 (4.5); 7.2417 (3.6); 7.2403 (3.5); 7.2334 (0.6); 7.2261 (2.3); 7.2223 (3.8); 7.2168 (2.1); 7.2046 (2.6); 7.2019 (1.9); 7.1997 (2.1); 7.1876 (1.0); 7.1826 (0.8); 6.9968 (0.6); 5.6179 (0.9); 5.5986 (2.6); 5.5789 (2.8); 5.5597 (1.1); 5.3859 (1.4); 5.3648 (1.2); 3.1486 (0.5); 3.0496 (0.8); 3.0405 (0.9); 3.0278 (0.8); 3.0189 (0.9); 3.0099 (1.6); 3.0009 (1.8); 2.9882 (1.7); 2.9793 (1.8); 2.9391 (1.2); 2.9183 (2.6); 2.8984 (2.0); 2.8786 (1.3); 2.8585 (0.8); 2.7252 (1.3); 2.7162 (1.2); 2.7058 (1.6); 2.6979 (1.6); 2.6936 (1.6); 2.6875 (1.4); 2.6845 (1.5); 2.6785 (1.2); 2.6752 (1.8); 2.6742 (1.8); 2.6662 (1.7); 2.6558 (1.3); 2.6468 (1.1); 2.0686 (0.8); 2.0453 (1.2); 1.9253 (1.4); 1.9062 (1.5); 1.9039 (2.8); 1.8937 (1.3); 1.8849 (2.7); 1.8825 (1.6); 1.8746 (1.5); 1.8723 (2.6); 1.8634 (1.3); 1.8532 (2.6); 1.8509 (1.4); 1.8317 (1.1); 1.6626 (1.1); 1.6437 (0.9); 1.6321 (0.8); 1.6173 (1.1); 1.5939 (123.8); 1.2595 (1.0); 1.2555 (0.6); 0.0079 (2.0); -0.0002 (76.4); -0.0059 (0.9); -0.0068 (0.7); -0.0085 (2.3)</p>
<p>1.31: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4442 (7.4); 7.2592 (47.8); 7.1866 (2.0); 7.1768 (3.3); 7.1709 (2.7); 7.1685 (3.0); 7.0964 (2.1); 7.0771 (1.4); 5.5694 (1.3); 5.5498 (1.5); 5.5308 (0.7); 5.4296 (0.8); 5.4093 (0.7); 2.9725 (0.5); 2.9636 (0.9); 2.9550 (0.9); 2.9421 (0.9); 2.9334 (0.9); 2.8929 (0.6); 2.8725 (1.4); 2.8527 (1.1); 2.8333 (0.7); 2.7240 (0.6); 2.7152 (0.6); 2.7056 (0.8); 2.6969 (0.9); 2.6925 (0.9); 2.6865 (0.8); 2.6836 (0.8); 2.6776 (0.7); 2.6740 (1.0); 2.6653 (1.0); 2.6522 (1.4); 2.6460 (0.8); 2.6331 (3.8); 2.6141 (4.0); 2.5951 (1.5); 1.9134 (0.6); 1.8921 (1.3); 1.8819 (0.6); 1.8731 (1.3); 1.8605 (1.2); 1.8517 (0.7); 1.8414 (1.2); 1.8199 (0.6); 1.6796 (7.1); 1.5932 (53.5); 1.5442 (0.7); 1.2810 (0.6); 1.2648 (1.9); 1.2584 (1.4); 1.2301 (7.7); 1.2111 (16.0); 1.1921 (7.6); 0.8987 (0.9); 0.8818 (2.9); 0.8641 (1.2); 0.0080 (0.9); -0.0002 (26.4); -0.0085 (1.2)</p>
<p>1.38: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4647 (4.3); 7.5181 (1.4); 7.2592 (248.5); 7.2082 (0.9); 7.0902 (2.5); 7.0053 (1.4); 6.9952 (1.3); 6.9851 (1.6); 6.7629 (3.5); 6.7422 (2.9); 5.2052 (1.1); 4.2649 (1.2); 4.2503 (1.4); 4.2421 (2.1); 4.2349 (1.5); 4.2132 (1.6); 2.2677 (1.2); 2.2416 (16.0); 2.1696 (3.2); 2.1493 (1.1); 2.1423 (1.1); 2.1279 (1.0); 2.1144 (0.8); 1.6721 (4.6); 1.5984 (44.3); 1.5405 (2.0); 1.2643 (1.0); 0.8820 (1.2); 0.8635 (0.7); 0.0078 (5.2); -0.0002 (106.4); -0.0085 (4.3)</p>
<p>1.45: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3730 (2.9); 7.3054 (1.5); 7.2966 (4.2); 7.2838 (6.0); 7.2746 (2.4); 7.2599 (48.2); 5.1504 (1.1); 5.0301 (0.9); 5.0152 (0.9); 4.4956 (0.6); 4.4754 (1.3); 4.4581 (1.2); 4.4380 (0.6); 3.4008 (1.1); 3.3809 (1.1); 3.3613 (1.3); 3.3416 (1.2); 3.0108 (1.1); 2.9893 (1.0); 2.9716 (0.9); 2.9500 (0.8); 2.4650 (16.0); 2.0433 (2.0); 1.8384 (0.8); 1.5392 (8.3); 1.5230 (8.2); 1.2762 (0.6); 1.2584 (1.3); 1.2406 (0.6); -0.0002 (18.7); -0.0081 (0.9)</p>
<p>1.46: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3307 (0.6); 7.2676 (0.7); 7.2594 (66.3); 7.1358 (0.6); 7.1164 (1.4); 7.0967 (0.8); 6.9844 (1.0); 6.9650 (0.8); 6.7357 (1.2); 6.7173 (1.1); 5.0059 (0.5); 4.9965 (0.5); 4.9899 (0.5); 4.9805 (0.5); 3.8261 (16.0); 2.7101 (0.6); 2.6527 (0.6); 2.4185 (7.2); 2.0433 (1.0); 1.9062 (0.6); 1.8917 (0.8); 1.8797 (0.8); 1.8618 (1.1); 1.8452 (0.7); 1.6675 (0.7); 1.6584 (0.7); 1.5349 (6.9); 1.5186 (6.8); 0.0080 (0.9); -0.0002 (27.6); -0.0085 (0.8)</p>
<p>1.47: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3280 (1.8); 7.3384 (1.2); 7.3205 (1.5); 7.2594 (26.6); 7.2504 (1.6); 7.2464 (2.7); 7.2438 (2.7); 7.2296 (1.7); 7.2274 (1.5); 7.2117 (0.8); 7.2053 (1.2); 7.1998 (0.8); 7.1874 (1.1); 7.1827 (0.9); 5.6212 (0.9); 5.6015 (0.9); 5.0053 (0.9); 4.9892 (0.8); 4.1292 (0.5); 4.1114 (0.5); 2.9974 (0.7); 2.9885 (0.7); 2.9757 (0.7); 2.9669 (0.7); 2.9284 (0.5); 2.9079 (1.1); 2.8876 (0.8); 2.8687 (0.5); 2.6928 (0.7); 2.6839 (0.6); 2.6808 (0.5); 2.6720 (0.5); 2.6611 (0.7); 2.6522 (0.6); 2.4125 (16.0); 2.0424 (2.4); 1.8848 (0.9); 1.8826 (0.7); 1.8654 (0.6); 1.8632 (0.9); 1.8531 (0.8); 1.8509 (0.6); 1.8336 (0.6); 1.8315 (0.8); 1.7599 (0.8); 1.5337 (10.3); 1.5175 (10.2); 1.2757 (0.8); 1.2578 (1.5); 1.2399 (0.7); -0.0002 (11.1)</p>

<p>1.48: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3222 (1.7); 7.2591 (33.2); 7.1638 (2.8); 7.0122 (0.6); 6.9910 (7.1); 6.9867 (3.7); 5.2488 (1.0); 5.2338 (0.8); 5.0036 (0.9); 4.9948 (1.0); 4.9876 (1.0); 4.9787 (0.9); 2.7958 (0.7); 2.7797 (1.2); 2.7597 (0.8); 2.7443 (1.1); 2.7279 (0.7); 2.4074 (16.0); 2.2610 (15.2); 2.1015 (0.5); 2.0932 (0.6); 2.0819 (0.8); 2.0695 (0.6); 2.0426 (1.6); 1.9110 (0.7); 1.9048 (0.7); 1.8905 (1.2); 1.8839 (1.3); 1.8727 (1.5); 1.8681 (1.6); 1.8564 (1.3); 1.8485 (1.6); 1.8329 (0.8); 1.7305 (1.4); 1.5337 (12.3); 1.5175 (12.1); 1.2758 (0.5); 1.2580 (1.0); -0.0002 (13.8)</p>
<p>1.49: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3357 (1.7); 7.2597 (56.1); 7.0894 (1.8); 7.0872 (1.8); 6.9955 (0.5); 6.9917 (1.1); 6.9862 (1.0); 6.9709 (1.2); 6.9653 (1.1); 6.7497 (2.8); 6.7289 (2.4); 5.2014 (0.8); 5.1834 (0.7); 5.0178 (0.7); 5.0084 (0.8); 5.0016 (0.8); 4.9921 (0.7); 4.2544 (0.9); 4.2454 (0.8); 4.2394 (1.0); 4.2296 (1.5); 4.2217 (1.0); 4.2068 (0.9); 4.2001 (1.1); 2.4234 (16.0); 2.2627 (0.7); 2.2598 (0.6); 2.2534 (0.6); 2.2503 (0.8); 2.2469 (0.6); 2.2330 (13.0); 2.1354 (0.6); 2.1277 (0.6); 2.0432 (1.5); 1.6864 (1.2); 1.6770 (1.2); 1.5369 (8.6); 1.5207 (8.5); 1.2584 (1.1); 0.0079 (0.7); -0.0002 (23.4); -0.0085 (0.7)</p>
<p>1.50: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3483 (1.6); 7.2592 (66.5); 7.1679 (2.7); 7.1578 (2.3); 7.0856 (1.7); 7.0663 (1.1); 5.5936 (0.9); 5.5739 (0.9); 5.0203 (0.8); 5.0111 (0.8); 5.0040 (0.8); 4.9949 (0.8); 2.9557 (0.7); 2.9471 (0.7); 2.9340 (0.7); 2.9257 (0.7); 2.8849 (0.5); 2.8647 (1.1); 2.8445 (0.8); 2.8250 (0.6); 2.8205 (0.6); 2.6948 (0.7); 2.6862 (0.7); 2.6822 (0.6); 2.6736 (0.6); 2.6632 (0.8); 2.6545 (0.8); 2.6439 (1.4); 2.6355 (0.6); 2.6248 (3.1); 2.6058 (3.2); 2.5869 (1.1); 2.4309 (16.0); 2.0432 (2.3); 1.8810 (0.8); 1.8595 (0.8); 1.8496 (0.8); 1.8279 (0.7); 1.6879 (1.3); 1.6788 (1.3); 1.5421 (10.7); 1.5259 (10.6); 1.2762 (0.8); 1.2584 (1.5); 1.2405 (0.8); 1.2256 (6.4); 1.2066 (13.4); 1.1876 (6.1); 0.0080 (1.0); -0.0002 (28.1); -0.0085 (0.8)</p>
<p>1.44: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 7.2592 (57.7); 7.1173 (0.9); 7.0975 (0.6); 6.9880 (0.7); 6.9685 (0.6); 6.7356 (0.7); 6.7173 (0.6); 3.8259 (9.0); 2.6305 (3.0); 2.1694 (1.0); 1.8646 (0.6); 1.6446 (16.0); 1.5773 (1.3); 0.8819 (0.5); 0.0079 (0.8); -0.0002 (24.9); -0.0085 (0.8)</p>
<p>1.51: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.2974 (0.7); 8.2881 (1.0); 7.3018 (0.6); 7.2593 (30.6); 7.2397 (0.5); 7.2316 (0.8); 7.2280 (1.2); 7.2222 (1.5); 7.2182 (1.5); 7.2145 (1.0); 7.2135 (1.0); 7.2043 (1.2); 7.2009 (1.4); 7.1913 (1.8); 7.1891 (1.2); 2.6519 (0.5); 2.6427 (0.5); 2.6208 (6.7); 2.6157 (9.4); 2.6046 (0.7); 2.0428 (1.0); 1.6499 (14.1); 1.6471 (16.0); 1.6059 (0.6); 1.5992 (3.7); 1.5798 (0.8); 1.2993 (3.8); 1.2825 (4.0); 1.2759 (1.2); 1.2649 (1.9); 1.2581 (1.6); 0.9411 (3.9); 0.9234 (3.9); 0.8987 (1.1); 0.8818 (3.8); 0.8640 (1.4); -0.0002 (13.5)</p>
<p>1.43: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4476 (4.2); 7.5182 (0.7); 7.2593 (123.0); 7.1642 (3.2); 7.0265 (0.5); 7.0054 (8.4); 6.9953 (0.9); 5.2429 (1.0); 5.2218 (0.9); 2.8089 (0.8); 2.7931 (1.2); 2.7778 (0.6); 2.7672 (0.7); 2.7520 (1.1); 2.7360 (0.7); 2.2699 (16.0); 2.1696 (0.6); 2.1287 (0.5); 2.1123 (0.5); 2.1054 (0.8); 2.0947 (0.9); 2.0838 (0.6); 2.0668 (0.6); 2.0434 (0.9); 1.9337 (0.6); 1.9283 (0.8); 1.9196 (0.7); 1.9123 (1.3); 1.9057 (1.2); 1.8971 (1.8); 1.8916 (1.2); 1.8801 (1.7); 1.8745 (1.5); 1.8642 (1.2); 1.8590 (1.8); 1.8428 (0.8); 1.6687 (6.2); 1.6197 (1.4); 1.5936 (60.3); 1.2762 (0.5); 1.2643 (0.8); 1.2585 (1.0); 0.8818 (1.2); 0.0080 (1.8); -0.0002 (53.7); -0.0085 (1.5)</p>
<p>1.56: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3309 (1.7); 7.5184 (0.8); 7.2944 (1.6); 7.2916 (1.5); 7.2901 (1.5); 7.2830 (3.0); 7.2781 (0.8); 7.2773 (0.8); 7.2765 (0.8); 7.2748 (1.1); 7.2741 (1.1); 7.2732 (1.2); 7.2717 (1.1); 7.2700 (1.4); 7.2693 (1.6); 7.2685 (1.6); 7.2678 (1.6); 7.2669 (1.7); 7.2661 (1.8); 7.2652 (2.1); 7.2595 (134.0); 7.2491 (0.6); 7.2483 (0.5); 7.2474 (0.5); 7.2371 (0.8); 6.9955 (0.8); 5.1205 (0.8); 5.1066 (0.6); 4.4671 (0.6); 4.4523 (0.6); 4.4507 (0.6); 4.4472 (0.5); 4.2003 (0.7); 4.1822 (1.0); 4.1640 (0.7); 3.4009 (0.5); 3.3615 (0.6); 3.3415 (0.6); 2.6620 (9.3); 2.3326 (3.4); 2.0433 (1.3); 1.6545 (16.0); 1.3064 (1.7); 1.2951 (0.7); 1.2886 (3.5); 1.2763 (0.8); 1.2708 (1.8); 1.2596 (2.3); 1.2540 (1.2); 1.2442 (1.9); 1.2406 (0.7); 0.8819 (1.0); 0.0080 (1.5); 0.0048 (0.6); 0.0040 (0.7); -0.0002 (52.0); -0.0066 (0.6); -0.0085 (1.4)</p>
<p>1.55: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4466 (2.9); 7.2594 (62.0); 7.2447 (0.6); 7.2411 (0.9); 7.2346 (1.0); 7.2318 (1.3); 7.2279 (0.9); 7.2175 (0.9); 7.2144 (1.1); 7.2110 (1.2); 7.2017 (1.6); 3.0929 (0.5); 3.0737 (0.5); 1.6650 (2.1); 1.6006 (16.0); 1.5961 (13.2); 1.3051 (3.2); 1.2883 (3.2); 0.9503 (2.7); 0.9326 (2.7); 0.0080 (0.7); -0.0002 (25.4); -0.0085 (0.8)</p>

1.54: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3201 (0.6); 7.3278 (0.5); 7.2594 (41.4); 7.2522 (0.8); 7.2480 (1.0); 7.2451 (1.0); 7.2312 (0.6); 7.2289 (0.5); 7.2091 (0.6); 2.6314 (6.0); 1.6497 (16.0); 1.5842 (1.8); -0.0002 (16.5)
1.52: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2949 (0.8); 7.2588 (11.7); 7.1748 (1.0); 6.9895 (2.2); 6.9848 (1.2); 5.2192 (0.9); 2.6062 (6.3); 2.2616 (4.9); 2.0424 (0.6); 1.8478 (0.6); 1.6414 (16.0); 1.6109 (1.5); 1.2755 (0.8); 1.2650 (1.6); 1.2580 (1.1); 0.8987 (0.8); 0.8818 (2.9); 0.8641 (1.1); -0.0002 (5.2)
1.53: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.5183 (0.5); 7.2594 (93.5); 7.0774 (0.9); 6.9953 (1.0); 6.9741 (0.6); 6.9686 (0.5); 6.7516 (1.4); 6.7308 (1.1); 4.2488 (0.8); 4.2419 (0.6); 4.2377 (0.5); 4.2213 (0.5); 2.6710 (2.7); 2.6593 (0.6); 2.2344 (6.4); 2.1697 (0.6); 1.6560 (16.0); 1.6143 (1.3); 1.5418 (0.8); 0.8819 (0.5); 0.0080 (1.2); -0.0002 (39.3); -0.0085 (1.2)
1.57: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3163 (1.1); 7.2592 (40.2); 7.1771 (1.6); 7.1576 (0.8); 7.0841 (0.6); 2.6451 (0.6); 2.6234 (7.9); 2.6073 (1.2); 1.6505 (16.0); 1.5726 (1.3); 1.2269 (2.5); 1.2080 (5.5); 1.1889 (2.4); -0.0002 (15.1)
1.58: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.7714 (2.7); 8.4129 (2.4); 7.5177 (1.0); 7.2719 (0.5); 7.2663 (1.2); 7.2588 (192.9); 7.1406 (1.3); 7.1082 (1.8); 7.0898 (3.0); 7.0542 (3.4); 7.0401 (2.6); 7.0211 (1.4); 6.9948 (1.0); 5.4121 (0.8); 5.3898 (1.0); 5.2741 (1.3); 5.2529 (2.0); 5.2311 (1.0); 4.1303 (0.9); 4.1124 (0.9); 3.2093 (2.0); 3.0927 (1.1); 3.0738 (1.2); 3.0546 (1.4); 3.0352 (1.4); 2.9891 (0.5); 2.5662 (0.9); 2.5432 (1.1); 2.5258 (0.9); 2.5035 (1.1); 2.3330 (5.7); 2.3175 (1.1); 2.3012 (15.7); 2.2804 (1.0); 2.2649 (3.3); 2.2175 (0.7); 2.1989 (1.1); 2.1802 (1.4); 2.1619 (1.2); 2.1427 (0.6); 2.0662 (1.3); 2.0478 (1.7); 2.0435 (4.5); 2.0294 (1.2); 2.0107 (0.8); 2.0044 (1.3); 1.5553 (3.2); 1.3196 (5.4); 1.3028 (5.9); 1.2950 (16.0); 1.2781 (15.9); 1.2651 (3.0); 1.2584 (4.3); 1.2405 (1.6); 0.9450 (4.3); 0.9264 (8.3); 0.9076 (3.9); 0.8986 (2.2); 0.8963 (2.2); 0.8819 (6.6); 0.8774 (2.6); 0.8759 (2.5); 0.8641 (2.4); 0.8586 (1.1); 0.0079 (2.0); 0.0062 (0.6); 0.0054 (0.6); 0.0046 (0.8); -0.0002 (67.8); -0.0028 (3.3); -0.0052 (1.0); -0.0061 (0.7); -0.0069 (0.6); -0.0085 (2.0)
1.61: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.7360 (0.7); 8.4536 (10.6); 7.5178 (0.5); 7.2589 (95.1); 7.1008 (1.7); 7.0818 (2.7); 7.0494 (3.1); 7.0278 (2.2); 7.0088 (1.3); 6.9949 (0.6); 5.2436 (1.7); 5.2275 (3.2); 3.0807 (1.0); 3.0617 (1.1); 3.0422 (1.2); 3.0233 (1.2); 2.5611 (0.9); 2.5385 (1.0); 2.5224 (0.8); 2.5001 (0.9); 2.3339 (0.5); 2.3211 (0.6); 2.2934 (12.9); 2.2639 (0.7); 1.5566 (1.4); 1.5255 (14.9); 1.5238 (15.2); 1.5090 (2.1); 1.4860 (1.2); 1.3217 (0.6); 1.2984 (7.8); 1.2965 (8.2); 1.2816 (8.0); 1.2797 (8.3); 1.2648 (2.7); 1.0078 (16.0); 0.9310 (1.0); 0.9174 (1.1); 0.9052 (1.4); 0.8986 (1.7); 0.8936 (1.9); 0.8819 (5.0); 0.8641 (1.7); 0.7779 (0.7); 0.7662 (1.2); 0.7540 (1.3); 0.7421 (0.9); 0.7308 (0.6); 0.3963 (0.6); 0.3849 (0.8); 0.3735 (1.4); 0.3621 (1.6); 0.3508 (1.2); 0.3338 (1.6); 0.3243 (1.6); 0.3212 (1.6); 0.3109 (1.8); 0.3014 (0.8); 0.2983 (0.8); 0.2881 (0.7); 0.0080 (1.2); -0.0002 (36.2); -0.0086 (1.3)
1.60: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.3148 (5.3); 7.5179 (0.5); 7.2637 (9.3); 7.2590 (72.5); 7.2356 (1.4); 7.2255 (1.9); 7.2129 (1.6); 7.0989 (0.6); 7.0800 (4.0); 7.0667 (6.4); 5.4440 (0.8); 5.4213 (0.9); 5.2658 (1.1); 4.8215 (1.1); 4.8052 (1.1); 4.1299 (0.5); 4.1120 (0.6); 2.7316 (0.6); 2.6880 (1.2); 2.6522 (0.8); 2.6380 (1.2); 2.6212 (0.8); 2.2448 (16.0); 2.0886 (0.6); 2.0658 (1.0); 2.0537 (1.2); 2.0431 (3.1); 2.0254 (0.6); 1.9941 (0.5); 1.9669 (0.8); 1.9514 (1.1); 1.9294 (2.2); 1.9127 (2.5); 1.7238 (1.3); 1.5356 (11.1); 1.5193 (10.8); 1.2762 (1.0); 1.2584 (1.8); 1.2405 (0.8); 0.8817 (0.6); 0.0045 (3.5); -0.0002 (26.6); -0.0085 (0.9)
1.41: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4375 (7.4); 7.5178 (1.0); 7.2590 (178.9); 7.2450 (1.3); 7.2358 (1.7); 7.2304 (0.8); 7.2218 (1.3); 7.0993 (0.5); 7.0807 (3.4); 7.0755 (2.8); 7.0666 (7.6); 6.9950 (1.0); 5.3459 (0.6); 5.2648 (1.0); 5.2446 (0.6); 2.6897 (1.0); 2.6748 (0.5); 2.6535 (0.6); 2.6388 (1.0); 2.6219 (0.7); 2.2451 (16.0); 2.0688 (0.7); 2.0577 (0.9); 2.0432 (0.9); 1.9719 (0.6); 1.9574 (0.8); 1.9417 (1.1); 1.9321 (1.6); 1.9272 (1.5); 1.9152 (2.2); 1.8989 (1.0); 1.8943 (0.9); 1.8891 (0.8); 1.6309 (9.3); 1.6235 (0.5); 1.5885 (56.3); 1.5437 (3.1); 0.0080 (2.3); -0.0002 (66.9); -0.0085 (2.0)

<p>1.63: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4402 (0.6); 8.3765 (16.0); 7.5181 (1.2); 7.2754 (0.5); 7.2738 (0.7); 7.2731 (0.7); 7.2714 (0.8); 7.2706 (0.9); 7.2699 (1.0); 7.2691 (1.1); 7.2682 (1.2); 7.2674 (1.4); 7.2666 (1.6); 7.2658 (1.9); 7.2592 (206.0); 7.1016 (1.6); 7.0830 (2.7); 7.0481 (3.0); 7.0301 (2.2); 7.0111 (1.2); 6.9952 (1.2); 5.2661 (0.6); 5.2431 (1.6); 5.2237 (2.5); 5.0354 (1.9); 5.0331 (2.4); 5.0301 (2.4); 5.0278 (2.0); 4.8654 (1.8); 4.8618 (2.3); 4.8600 (2.3); 4.8565 (1.8); 3.6658 (6.5); 3.0822 (1.1); 3.0628 (1.2); 3.0433 (1.2); 3.0244 (1.2); 2.5614 (0.8); 2.5390 (1.0); 2.5231 (0.7); 2.5005 (0.9); 2.3217 (0.6); 2.2943 (13.9); 2.2653 (0.7); 2.1159 (0.5); 2.1139 (0.7); 2.1123 (0.7); 2.1102 (0.6); 1.7272 (11.0); 1.7259 (11.2); 1.5953 (0.5); 1.5677 (45.8); 1.5426 (33.7); 1.2977 (13.6); 1.2808 (13.2); 0.0079 (3.3); 0.0063 (1.1); 0.0054 (1.2); 0.0046 (1.5); -0.0002 (108.8); -0.0051 (1.8); -0.0060 (1.4); -0.0068 (1.1); -0.0085 (3.1)</p>
<p>1.59: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3390 (0.9); 7.2594 (13.0); 7.1483 (0.7); 7.1285 (1.6); 7.1086 (1.0); 6.9975 (1.4); 6.9781 (1.1); 6.7452 (1.3); 6.7256 (1.2); 3.8310 (16.0); 2.7131 (0.6); 2.6470 (0.6); 2.0300 (0.6); 1.9051 (0.5); 1.8897 (0.6); 1.8822 (0.7); 1.8783 (0.6); 1.8737 (0.8); 1.8646 (1.0); 1.8540 (1.0); 1.8471 (0.6); 1.7498 (1.4); 1.5607 (20.8); -0.0002 (5.5)</p>
<p>1.64: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4336 (1.0); 7.2659 (0.6); 7.2651 (0.6); 7.2643 (0.8); 7.2634 (0.9); 7.2626 (1.2); 7.2585 (67.0); 7.1628 (2.1); 7.1465 (4.8); 7.1453 (4.9); 7.0750 (2.2); 7.0733 (2.3); 7.0560 (1.4); 7.0539 (1.5); 5.6459 (0.6); 5.6267 (0.9); 5.5920 (0.9); 5.5738 (1.8); 5.5539 (1.4); 2.9710 (0.5); 2.9627 (0.8); 2.9538 (0.9); 2.9412 (0.8); 2.9323 (0.9); 2.8900 (0.6); 2.8700 (1.3); 2.8504 (1.0); 2.8311 (0.7); 2.7109 (0.8); 2.7018 (0.8); 2.6929 (1.0); 2.6915 (1.0); 2.6838 (1.0); 2.6823 (0.9); 2.6791 (1.0); 2.6734 (0.9); 2.6699 (0.9); 2.6641 (0.8); 2.6612 (1.0); 2.6597 (1.0); 2.6520 (1.0); 2.6417 (0.7); 2.6325 (0.6); 2.5831 (1.6); 2.3268 (16.0); 2.0434 (0.5); 1.9021 (0.5); 1.8994 (1.2); 1.8968 (0.9); 1.8889 (0.5); 1.8808 (0.9); 1.8782 (1.2); 1.8754 (0.6); 1.8704 (0.6); 1.8677 (1.1); 1.8650 (0.8); 1.8596 (0.5); 1.8570 (0.5); 1.8492 (0.8); 1.8465 (1.0); 1.7637 (12.7); 1.7613 (13.0); 1.5851 (2.6); 1.2648 (0.9); 1.2583 (0.8); 0.8988 (0.5); 0.8818 (1.8); 0.8641 (0.7); 0.0079 (0.8); -0.0002 (26.6); -0.0085 (0.8)</p>
<p>1.62: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3508 (4.5); 7.2591 (25.0); 7.1019 (0.5); 7.0828 (0.9); 7.0498 (1.0); 7.0296 (0.7); 5.2495 (1.0); 5.2354 (0.6); 3.3086 (0.6); 3.2910 (2.2); 3.2735 (2.3); 3.2560 (0.7); 2.2948 (4.6); 1.5319 (16.0); 1.2977 (4.4); 1.2809 (4.3); 1.1911 (2.5); 1.1736 (5.5); 1.1561 (2.5); -0.0002 (9.9)</p>
<p>1.65: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4024 (2.7); 7.2594 (67.2); 7.1002 (1.1); 7.0804 (1.9); 7.0297 (5.0); 7.0120 (1.0); 5.2978 (1.7); 5.2612 (0.8); 5.2396 (1.3); 5.2175 (0.7); 4.3362 (2.5); 3.7029 (16.0); 3.7021 (15.9); 3.0858 (0.8); 3.0666 (0.9); 3.0472 (1.0); 3.0280 (1.0); 2.9383 (1.0); 2.9337 (1.0); 2.8978 (1.8); 2.8932 (1.8); 2.8065 (3.6); 2.7660 (2.0); 2.5580 (0.6); 2.5355 (0.8); 2.5205 (0.6); 2.4971 (0.7); 2.3130 (0.9); 2.2924 (10.8); 2.2786 (0.7); 1.5690 (10.7); 1.2849 (10.0); 1.2681 (9.9); 1.2583 (0.7); 0.8818 (0.8); 0.0080 (1.0); -0.0002 (28.2); -0.0085 (0.8)</p>
<p>1.66: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3830 (5.7); 7.2673 (0.5); 7.2665 (0.6); 7.2657 (0.7); 7.2649 (0.9); 7.2641 (1.1); 7.2600 (50.7); 7.2568 (1.2); 7.2559 (0.8); 7.2551 (0.6); 7.1047 (0.7); 7.0857 (1.1); 7.0431 (1.4); 7.0343 (1.0); 7.0155 (0.5); 5.2985 (2.2); 5.2607 (0.5); 5.2395 (0.7); 3.8994 (7.4); 3.7401 (14.3); 3.0279 (0.5); 2.2989 (5.7); 1.5899 (16.0); 1.2941 (5.4); 1.2773 (5.2); 0.0080 (0.7); -0.0002 (22.0); -0.0085 (0.6)</p>
<p>1.67: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4794 (1.9); 7.5179 (1.0); 7.3493 (2.1); 7.3316 (3.2); 7.3134 (0.6); 7.2834 (2.0); 7.2698 (6.4); 7.2660 (7.8); 7.2591 (191.8); 7.2364 (2.8); 7.2316 (3.8); 7.2252 (2.4); 7.2142 (2.4); 7.1966 (1.1); 6.9951 (1.0); 5.7521 (0.7); 5.6411 (0.9); 5.6223 (2.2); 5.6033 (2.0); 5.5842 (0.7); 3.0673 (0.6); 3.0575 (0.8); 3.0454 (0.8); 3.0355 (0.8); 3.0273 (1.3); 3.0180 (1.5); 3.0054 (1.4); 2.9958 (1.3); 2.9495 (1.2); 2.9289 (2.2); 2.9083 (1.7); 2.8886 (1.1); 2.8692 (0.7); 2.7273 (0.9); 2.7179 (1.0); 2.7080 (1.2); 2.6994 (1.2); 2.6953 (1.3); 2.6891 (1.1); 2.6858 (1.2); 2.6797 (1.1); 2.6763 (1.4); 2.6674 (1.3); 2.6572 (1.0); 2.6479 (0.8); 2.4983 (6.0); 2.4858 (3.5); 1.9573 (0.7); 1.9360 (1.6); 1.9244 (0.8); 1.9166 (1.5); 1.9040 (1.5); 1.8965 (1.0); 1.8848 (1.5); 1.8633 (0.8); 1.8152 (0.7); 1.7781 (15.6); 1.7757 (16.0); 0.1563 (0.9); 0.0080 (2.2); -0.0002 (73.0); -0.0085 (2.9)</p>

<p>1.68: ¹H-NMR(400.6 MHz, MeOD): δ= 8.4334 (0.8); 7.1453 (0.7); 7.1254 (1.5); 7.1055 (0.9); 6.9084 (1.1); 6.9069 (1.1); 6.8890 (1.0); 6.8874 (0.9); 6.8163 (1.3); 6.7962 (1.1); 5.5108 (0.5); 5.2390 (0.6); 4.8818 (30.4); 3.8338 (16.0); 3.3395 (3.8); 3.3354 (7.5); 3.3313 (11.4); 3.3272 (7.7); 3.3230 (3.8); 2.7210 (0.6); 2.6776 (0.6); 2.5048 (0.8); 1.9897 (0.8); 1.7240 (5.5)</p>
<p>1.72: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3848 (4.4); 7.5184 (0.8); 7.2595 (145.6); 7.1057 (0.6); 7.0867 (1.0); 7.0447 (1.2); 7.0344 (0.9); 6.9955 (0.8); 5.2631 (0.5); 5.2439 (0.6); 3.9393 (3.8); 3.9332 (3.8); 2.3930 (0.9); 2.3870 (1.9); 2.3808 (0.9); 2.2980 (5.0); 1.5905 (14.6); 1.5374 (16.0); 1.2970 (4.4); 1.2802 (4.3); 0.0080 (1.6); -0.0002 (57.0); -0.0085 (2.1)</p>
<p>1.69: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4628 (1.4); 7.5181 (1.2); 7.3879 (0.5); 7.3756 (0.6); 7.3594 (1.2); 7.3421 (1.2); 7.3385 (1.3); 7.3094 (0.6); 7.2592 (210.6); 7.2061 (0.6); 7.1932 (1.3); 7.1888 (1.4); 7.1757 (3.5); 7.1696 (3.8); 7.1566 (2.1); 7.1522 (1.5); 7.1315 (1.7); 7.1128 (0.8); 7.0893 (0.6); 6.9952 (1.2); 5.5015 (0.5); 5.2970 (0.7); 5.2791 (0.7); 2.8600 (0.6); 2.8442 (1.0); 2.8227 (0.8); 2.8074 (1.0); 2.7913 (0.8); 2.7757 (0.7); 2.7608 (0.7); 2.4946 (4.3); 2.3509 (2.8); 2.1362 (0.6); 2.1267 (0.6); 2.1154 (0.8); 2.1050 (0.7); 2.0897 (0.6); 1.9426 (0.9); 1.9359 (0.9); 1.9268 (1.1); 1.9105 (1.3); 1.8961 (1.6); 1.8852 (1.1); 1.8694 (0.7); 1.8456 (1.0); 1.8351 (1.2); 1.8223 (0.8); 1.7720 (8.6); 1.7697 (8.6); 1.5412 (16.0); 1.2583 (0.6); 0.0080 (2.8); -0.0002 (83.2); -0.0085 (3.0)</p>
<p>1.71: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4885 (3.3); 7.3280 (1.0); 7.3095 (1.3); 7.2584 (18.9); 7.2428 (2.5); 7.2398 (2.6); 7.2260 (1.7); 7.2051 (1.3); 7.1878 (0.9); 6.1458 (0.6); 6.1241 (0.6); 5.6742 (0.6); 5.6612 (0.7); 5.6524 (0.6); 5.6395 (0.6); 5.2957 (0.6); 4.2324 (0.8); 4.2276 (0.9); 4.2199 (1.2); 4.2151 (1.2); 4.2075 (0.8); 4.2027 (0.7); 3.4007 (0.9); 3.3843 (4.6); 3.3750 (16.0); 3.1585 (0.7); 3.1543 (0.7); 3.1174 (1.4); 3.1132 (1.4); 3.0386 (1.0); 3.0267 (1.0); 2.9974 (0.6); 2.9856 (0.5); 2.5060 (4.3); 1.7740 (6.9); 1.7722 (7.0); 1.2576 (1.0); -0.0002 (7.0)</p>
<p>1.70: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4651 (1.8); 7.5181 (1.5); 7.3077 (0.6); 7.2592 (262.8); 7.2348 (1.1); 7.2261 (1.7); 7.2126 (1.2); 7.2097 (1.1); 7.1097 (0.9); 7.1029 (1.0); 7.0900 (3.4); 7.0850 (3.4); 7.0760 (6.8); 7.0651 (0.9); 7.0443 (0.5); 6.9952 (1.6); 5.4931 (0.7); 5.4710 (0.8); 5.2982 (0.8); 5.2826 (0.9); 5.2625 (0.8); 3.0190 (0.8); 2.9342 (1.4); 2.7392 (0.6); 2.7113 (0.8); 2.6960 (1.2); 2.6814 (0.7); 2.6553 (2.9); 2.6414 (1.2); 2.6252 (0.9); 2.6145 (0.7); 2.5980 (0.7); 2.5850 (0.8); 2.3657 (1.3); 2.3496 (1.4); 2.2689 (1.0); 2.2477 (16.0); 2.2331 (1.6); 2.2149 (3.8); 2.0723 (0.9); 2.0613 (1.0); 2.0477 (0.8); 2.0315 (0.7); 2.0181 (0.6); 1.9537 (0.9); 1.9445 (1.3); 1.9397 (1.6); 1.9293 (2.2); 1.9180 (2.0); 1.9026 (1.5); 1.8835 (0.9); 1.8623 (0.9); 1.8347 (0.8); 1.7701 (9.6); 1.7682 (9.6); 1.5451 (9.8); 1.3441 (0.6); 1.3329 (0.6); 1.3261 (0.6); 1.2843 (1.1); 1.2557 (4.7); 0.8800 (0.8); 0.0079 (3.1); -0.0002 (101.2); -0.0085 (3.8)</p>
<p>1.73: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.5035 (3.9); 7.2591 (33.2); 7.0974 (0.6); 7.0784 (0.8); 7.0058 (0.6); 6.7736 (0.9); 5.1087 (0.5); 5.1045 (0.6); 5.0656 (1.1); 5.0615 (1.1); 5.0398 (0.6); 5.0357 (0.5); 2.5337 (0.6); 2.2691 (4.3); 1.6276 (2.5); 1.6044 (16.0); 1.5420 (11.5); 1.2384 (2.8); 1.2225 (2.7); -0.0002 (12.5)</p>
<p>1.80: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3655 (1.7); 7.2585 (56.6); 7.1094 (1.8); 7.0892 (3.1); 7.0370 (4.8); 7.0230 (1.8); 5.4801 (0.8); 5.2785 (1.3); 5.2569 (2.2); 5.2348 (1.1); 4.9181 (1.5); 4.9016 (1.5); 4.8849 (0.5); 3.0899 (1.2); 3.0707 (1.3); 3.0516 (1.4); 3.0321 (1.5); 2.8298 (0.7); 2.5652 (1.0); 2.5429 (1.1); 2.5266 (0.8); 2.5047 (1.0); 2.3263 (0.6); 2.2993 (16.0); 2.2735 (0.9); 2.0435 (2.1); 1.5732 (1.2); 1.2898 (8.8); 1.2878 (9.0); 1.2730 (9.1); 1.2709 (9.4); 1.2585 (2.4); 1.2406 (0.8); 0.8988 (1.0); 0.8819 (3.1); 0.8642 (1.3); 0.0079 (0.6); -0.0002 (19.8); -0.0084 (0.8)</p>
<p>1.74: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.5753 (1.2); 7.2586 (48.1); 7.1049 (1.4); 7.0857 (2.3); 7.0369 (5.3); 7.0180 (1.2); 5.4580 (0.7); 5.4394 (0.8); 5.2918 (1.1); 5.2699 (1.8); 5.2479 (0.8); 3.3592 (1.6); 3.0893 (1.0); 3.0701 (1.0); 3.0508 (1.1); 3.0314 (1.2); 2.5661 (0.8); 2.5440 (0.9); 2.5278 (0.7); 2.5052 (0.8); 2.2990 (11.4); 2.2750 (0.7); 1.9657 (16.0); 1.5765 (3.2); 1.2942 (6.4); 1.2894 (6.3); 1.2774 (6.5); 1.2726 (6.4); 0.8987 (0.7); 0.8818 (2.2); 0.8641 (0.9); 0.0079 (0.6); -0.0002 (18.0); -0.0085 (0.6)</p>

<p>1.75: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.5878 (1.2); 7.5177 (0.6); 7.2588 (95.9); 7.1096 (1.6); 7.0895 (2.9); 7.0402 (7.0); 7.0233 (1.6); 6.9949 (0.6); 5.4866 (0.8); 5.4643 (1.0); 5.2951 (1.3); 5.2738 (2.1); 5.2516 (1.0); 3.4218 (1.8); 3.0947 (1.2); 3.0754 (1.3); 3.0561 (1.4); 3.0369 (1.4); 2.8691 (8.1); 2.5686 (1.0); 2.5464 (1.2); 2.5310 (0.8); 2.5082 (1.0); 2.3197 (1.1); 2.3018 (16.0); 2.2823 (0.9); 1.5616 (3.8); 1.2939 (8.7); 1.2906 (7.5); 1.2771 (8.8); 1.2738 (7.5); 0.8987 (0.6); 0.8818 (2.0); 0.8641 (0.8); 0.0079 (1.2); -0.0002 (37.3); -0.0085 (1.5)</p>
<p>1.78: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3203 (2.8); 7.5178 (0.7); 7.2589 (122.1); 7.1112 (1.6); 7.0921 (2.8); 7.0451 (5.9); 7.0253 (1.4); 6.9948 (0.7); 5.4578 (0.8); 5.4344 (1.1); 5.2816 (1.3); 5.2601 (2.0); 5.2378 (1.0); 4.3960 (0.8); 4.3795 (2.6); 4.3631 (2.7); 4.3466 (0.9); 3.4804 (12.8); 3.4768 (12.0); 3.0960 (1.1); 3.0769 (1.2); 3.0580 (1.3); 3.0386 (1.4); 2.5698 (0.9); 2.5472 (1.1); 2.5311 (0.8); 2.5089 (1.0); 2.3396 (0.5); 2.3194 (1.0); 2.3031 (16.0); 2.2832 (0.9); 1.5509 (10.1); 1.2973 (7.8); 1.2945 (8.3); 1.2805 (7.6); 1.2777 (8.0); 0.0080 (1.5); -0.0002 (44.6); -0.0085 (1.6)</p>
<p>1.77: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4334 (5.4); 7.3338 (5.0); 7.3227 (8.4); 7.2780 (0.6); 7.2662 (0.9); 7.2576 (28.4); 7.2488 (0.6); 7.1028 (0.8); 7.0838 (1.2); 7.0570 (1.5); 7.0305 (1.0); 7.0111 (0.6); 5.2669 (1.0); 5.2472 (0.8); 4.3115 (5.9); 3.0650 (0.5); 3.0457 (0.6); 3.0265 (0.6); 2.2935 (6.5); 1.6348 (16.0); 1.5671 (1.1); 1.3017 (5.4); 1.2849 (5.3); -0.0002 (10.7)</p>
<p>1.76: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3649 (5.8); 7.2593 (31.7); 7.1015 (0.6); 7.0826 (1.0); 7.0466 (1.2); 7.0296 (0.8); 5.2423 (1.0); 5.2313 (1.1); 3.0828 (0.5); 3.0596 (1.5); 3.0520 (1.3); 3.0425 (1.8); 3.0350 (1.3); 3.0243 (0.5); 2.2954 (5.4); 1.5640 (1.3); 1.5354 (16.0); 1.2976 (4.7); 1.2808 (4.6); 0.5322 (1.1); 0.5290 (1.2); 0.5238 (0.6); 0.5177 (0.6); 0.5121 (1.2); 0.5089 (1.1); 0.1409 (1.4); 0.1381 (1.3); 0.1289 (1.2); 0.1260 (1.4); -0.0002 (12.2)</p>
<p>1.79: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.2853 (1.0); 7.2586 (61.9); 7.0982 (1.8); 7.0792 (3.0); 7.0449 (2.9); 7.0290 (2.6); 7.0097 (1.4); 5.2973 (1.0); 5.2539 (2.0); 3.0791 (1.1); 3.0597 (1.2); 3.0404 (1.3); 3.0213 (1.4); 2.6089 (16.0); 2.5572 (1.0); 2.5345 (1.2); 2.5187 (0.8); 2.4962 (1.0); 2.3617 (2.6); 2.3178 (0.5); 2.2965 (15.2); 2.2736 (0.8); 2.2707 (0.9); 2.2537 (0.6); 2.2512 (0.6); 1.8448 (11.7); 1.5654 (2.0); 1.2863 (12.0); 1.2695 (11.6); 1.2556 (0.6); 0.0080 (1.2); -0.0002 (36.9); -0.0085 (1.3)</p>
<p>1.81: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 7.2592 (45.7); 7.1515 (0.7); 7.1454 (0.7); 7.1317 (1.6); 7.1258 (1.4); 7.1118 (0.9); 7.1059 (0.9); 6.9873 (1.0); 6.9678 (0.8); 6.9461 (1.4); 6.9266 (1.2); 6.7551 (1.4); 6.7402 (1.3); 6.7356 (1.3); 6.7216 (1.0); 3.8317 (16.0); 3.8274 (14.0); 2.7119 (1.0); 2.6962 (1.0); 2.6680 (1.1); 2.6525 (1.0); 2.6362 (0.7); 2.6125 (1.7); 2.5909 (2.9); 2.5081 (1.8); 2.4837 (1.0); 2.3920 (1.2); 2.0629 (0.6); 2.0514 (0.7); 2.0427 (0.6); 2.0393 (0.7); 1.9136 (0.7); 1.8990 (1.2); 1.8832 (1.8); 1.8741 (2.1); 1.8598 (1.4); 1.8442 (0.6); 1.8289 (5.0); 1.8273 (5.0); 1.5720 (3.4); 1.2650 (1.2); 0.8986 (0.6); 0.8818 (1.9); 0.8641 (0.8); 0.0078 (0.5); -0.0002 (16.8); -0.0084 (0.7)</p>
<p>1.82: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4321 (2.9); 7.7582 (0.7); 7.7553 (0.8); 7.7394 (0.8); 7.7360 (0.8); 7.5572 (0.7); 7.5372 (0.7); 7.2595 (92.5); 7.2222 (0.7); 7.2029 (1.1); 7.1835 (0.5); 6.9955 (0.5); 3.8876 (11.2); 3.8742 (0.7); 1.8994 (0.6); 1.8876 (0.8); 1.8772 (0.7); 1.6640 (2.9); 1.6111 (0.5); 1.5908 (16.0); 1.5441 (4.3); 0.0080 (1.0); -0.0002 (32.9); -0.0085 (1.2)</p>
<p>1.84: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4265 (0.6); 7.7646 (1.1); 7.7614 (1.1); 7.7454 (1.2); 7.7422 (1.2); 7.5454 (1.0); 7.5265 (1.2); 7.5184 (0.7); 7.2595 (102.1); 7.2351 (1.0); 7.2154 (1.8); 7.1961 (0.7); 6.9955 (0.6); 5.3360 (0.5); 5.3160 (0.5); 3.8910 (16.0); 3.0571 (0.7); 2.4379 (1.6); 2.4197 (1.6); 2.0814 (0.6); 1.9311 (0.5); 1.9146 (0.5); 1.8871 (1.2); 1.8775 (1.0); 1.8598 (0.6); 1.7663 (6.1); 1.5446 (4.5); 0.0079 (1.1); -0.0002 (39.0); -0.0085 (1.7)</p>

1.96: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2866 (1.2); 7.2577 (19.8); 7.1700 (5.2); 7.1621 (4.4); 7.0905 (3.2); 7.0710 (2.0); 5.5900 (1.0); 5.5722 (1.1); 5.3875 (1.6); 5.3663 (1.3); 2.9969 (0.6); 2.9882 (0.7); 2.9750 (0.7); 2.9660 (0.8); 2.9577 (1.3); 2.9489 (1.3); 2.9359 (1.3); 2.9274 (1.3); 2.8877 (1.0); 2.8675 (2.0); 2.8475 (1.5); 2.8282 (1.0); 2.8077 (0.6); 2.7111 (0.8); 2.7023 (0.9); 2.6922 (1.3); 2.6833 (1.4); 2.6799 (1.3); 2.6708 (1.3); 2.6607 (1.7); 2.6485 (2.6); 2.6420 (1.7); 2.6290 (6.1); 2.6075 (15.6); 2.5916 (2.7); 2.5241 (2.9); 1.9041 (0.7); 1.8830 (1.6); 1.8725 (1.0); 1.8634 (1.8); 1.8511 (2.3); 1.8345 (16.0); 1.8106 (0.6); 1.6081 (1.0); 1.2547 (0.6); 1.2279 (7.8); 1.2090 (15.3); 1.1899 (7.2); -0.0002 (11.6)
1.95: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2717 (0.8); 7.3554 (2.2); 7.3374 (2.7); 7.2582 (50.7); 7.1950 (0.7); 7.1910 (0.9); 7.1772 (2.7); 7.1728 (2.9); 7.1597 (5.8); 7.1540 (5.8); 7.1403 (2.4); 7.1356 (3.1); 7.1167 (3.8); 7.1116 (2.9); 7.0975 (1.8); 7.0947 (1.8); 5.3726 (1.3); 5.2963 (2.2); 2.8735 (0.7); 2.8469 (1.3); 2.8313 (2.2); 2.8136 (1.7); 2.7972 (2.0); 2.7808 (1.3); 2.7553 (0.6); 2.5914 (10.6); 2.4817 (1.9); 2.4653 (2.0); 2.1688 (0.9); 2.1340 (0.9); 2.1209 (0.8); 2.1113 (1.2); 2.1001 (1.7); 2.0888 (1.1); 2.0739 (0.8); 2.0024 (1.3); 1.9421 (1.1); 1.9379 (1.2); 1.9316 (1.2); 1.9224 (2.0); 1.9151 (2.2); 1.9066 (3.1); 1.9014 (2.1); 1.8903 (4.0); 1.8756 (3.9); 1.8693 (2.0); 1.8594 (1.5); 1.8518 (1.2); 1.8271 (16.0); 1.5945 (1.5); 1.2547 (0.6); 0.0080 (1.2); -0.0002 (29.7); -0.0085 (1.0)
1.93: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2575 (20.8); 7.2312 (0.9); 7.2214 (1.3); 7.2085 (1.1); 7.0725 (3.5); 7.0686 (3.2); 7.0590 (6.8); 5.3867 (0.7); 5.3663 (0.9); 5.2957 (1.8); 5.2861 (0.6); 2.6961 (0.5); 2.6800 (1.0); 2.6655 (0.6); 2.6492 (0.6); 2.6344 (1.1); 2.6179 (0.9); 2.5864 (5.4); 2.5239 (1.7); 2.2393 (16.0); 2.0584 (0.7); 2.0470 (0.8); 2.0322 (0.6); 2.0020 (1.6); 1.9651 (0.6); 1.9507 (0.7); 1.9480 (0.8); 1.9429 (0.5); 1.9346 (1.1); 1.9236 (1.7); 1.9185 (1.7); 1.9081 (2.2); 1.8923 (1.3); 1.8871 (0.9); 1.8803 (0.9); 1.8234 (9.2); 1.8217 (9.1); 1.6095 (0.6); -0.0002 (12.5)
1.92: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2777 (0.5); 7.2581 (38.1); 7.1614 (3.0); 6.9971 (9.1); 5.3790 (0.8); 5.3592 (1.0); 5.2965 (3.6); 5.2446 (0.7); 2.7975 (0.8); 2.7818 (1.3); 2.7643 (0.9); 2.7469 (1.2); 2.7304 (0.8); 2.5942 (6.6); 2.4670 (1.6); 2.2673 (16.0); 2.1029 (0.5); 2.0923 (0.7); 2.0816 (1.0); 2.0705 (0.7); 2.0616 (0.6); 2.0540 (0.5); 1.9188 (0.8); 1.9054 (1.2); 1.8986 (1.2); 1.8834 (1.7); 1.8701 (1.8); 1.8660 (2.2); 1.8598 (1.5); 1.8503 (1.9); 1.8438 (1.4); 1.8302 (11.5); 1.5907 (1.2); 1.2549 (0.5); 0.0080 (0.8); -0.0002 (20.4); -0.0085 (0.6)
1.89: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2942 (1.1); 7.2585 (39.3); 7.1425 (3.7); 7.1324 (3.3); 7.0596 (2.4); 7.0404 (1.6); 5.5871 (0.8); 5.5678 (0.8); 5.3496 (1.0); 5.3294 (0.8); 5.2971 (1.3); 2.9603 (0.6); 2.9516 (0.9); 2.9429 (1.0); 2.9298 (0.9); 2.9214 (1.0); 2.8815 (0.7); 2.8613 (1.4); 2.8412 (1.1); 2.8224 (0.7); 2.7018 (0.6); 2.6931 (0.6); 2.6832 (1.0); 2.6744 (1.0); 2.6704 (0.9); 2.6639 (0.8); 2.6615 (0.9); 2.6516 (1.2); 2.6428 (1.1); 2.6325 (0.9); 2.6234 (1.2); 2.6085 (10.8); 2.3882 (2.4); 2.3204 (16.0); 1.9007 (0.6); 1.8795 (1.3); 1.8690 (0.7); 1.8599 (1.5); 1.8386 (13.0); 1.8289 (1.9); 1.5735 (1.5); 1.2553 (0.5); 0.0078 (1.0); -0.0002 (22.4); -0.0084 (1.0)
1.90: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2134 (1.8); 7.2588 (25.6); 7.0921 (0.9); 7.0731 (1.4); 7.0513 (1.5); 7.0183 (1.1); 6.9994 (0.7); 6.9951 (0.5); 5.2603 (0.7); 4.4168 (1.3); 4.4005 (1.4); 3.2759 (14.6); 3.2652 (0.6); 3.0698 (0.5); 3.0508 (0.6); 3.0314 (0.6); 3.0123 (0.6); 2.5304 (0.5); 2.3847 (16.0); 2.2894 (6.7); 2.2610 (0.6); 2.2591 (0.6); 1.4700 (7.0); 1.4537 (7.1); 1.2908 (4.0); 1.2874 (4.1); 1.2740 (4.1); 1.2706 (4.3); 0.8819 (1.6); 0.8641 (0.6); -0.0002 (12.7); -0.0084 (0.6)
1.88: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.2466 (1.8); 7.2586 (35.2); 7.0930 (1.1); 7.0740 (1.8); 7.0580 (1.9); 7.0191 (1.3); 7.0002 (0.8); 5.2583 (0.9); 5.2364 (0.6); 5.1411 (0.6); 4.9643 (1.6); 4.9033 (1.6); 4.5412 (1.5); 4.5249 (1.6); 3.8669 (0.7); 3.8357 (1.3); 3.7633 (1.5); 3.7316 (0.8); 3.0718 (0.6); 3.0527 (0.7); 3.0334 (0.7); 3.0143 (0.8); 2.5534 (0.5); 2.5312 (0.7); 2.4927 (0.5); 2.3741 (16.0); 2.2914 (8.4); 2.2638 (0.6); 1.7548 (7.4); 1.5715 (0.5); 1.4831 (7.4); 1.4668 (7.3); 1.2932 (4.6); 1.2905 (4.5); 1.2764 (4.6); 1.2737 (4.4); 0.0080 (0.5); -0.0002 (16.6); -0.0085 (0.7)

<p>1.87: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.4043 (8.7); 8.4014 (8.8); 7.5182 (0.9); 7.2593 (165.4); 7.1029 (1.7); 7.0839 (2.8); 7.0439 (3.2); 7.0311 (2.7); 7.0113 (1.4); 6.9953 (1.0); 5.2498 (2.3); 5.2392 (2.9); 4.0461 (0.9); 4.0408 (1.2); 4.0335 (1.1); 4.0294 (1.1); 4.0241 (1.2); 4.0170 (1.0); 3.0826 (1.0); 3.0634 (1.1); 3.0438 (1.2); 3.0246 (1.4); 2.5629 (1.0); 2.5401 (1.1); 2.5258 (0.8); 2.5019 (1.0); 2.3481 (3.8); 2.3468 (4.0); 2.3431 (4.0); 2.3418 (3.8); 2.2945 (14.8); 1.6720 (9.4); 1.6685 (9.6); 1.6356 (0.6); 1.5680 (16.0); 1.5465 (15.5); 1.3971 (7.4); 1.3918 (7.5); 1.3805 (7.4); 1.3752 (7.4); 1.2967 (9.9); 1.2800 (9.8); 1.2568 (1.2); 0.0079 (2.4); -0.0002 (82.5); -0.0085 (3.1)</p>
<p>1.86: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.3711 (6.1); 7.2594 (25.2); 7.1036 (0.7); 7.0846 (1.2); 7.0458 (1.4); 7.0322 (1.0); 7.0131 (0.5); 5.2767 (0.6); 5.2611 (0.7); 5.2409 (0.7); 3.8963 (1.0); 3.8904 (2.9); 3.8845 (3.0); 3.8787 (1.0); 3.0452 (0.5); 3.0258 (0.5); 2.2975 (5.9); 1.8337 (3.2); 1.8278 (6.6); 1.8219 (3.2); 1.5706 (16.0); 1.2963 (4.9); 1.2795 (4.8); -0.0002 (13.0)</p>
<p>1.85: ¹H-NMR(599.7 MHz, CDCl₃): δ= 8.3656 (2.8); 8.3529 (9.8); 7.2594 (23.1); 7.0994 (3.3); 7.0867 (4.6); 7.0508 (4.6); 7.0271 (3.5); 7.0144 (2.4); 5.7274 (0.3); 5.7166 (1.0); 5.7146 (0.6); 5.7058 (1.1); 5.7038 (0.8); 5.6932 (1.0); 5.6912 (1.5); 5.6893 (0.8); 5.6823 (0.8); 5.6804 (1.5); 5.6785 (0.8); 5.6697 (0.5); 5.6026 (0.5); 5.6005 (0.4); 5.5914 (0.6); 5.5797 (0.8); 5.5770 (0.8); 5.5742 (0.4); 5.5719 (0.6); 5.5694 (1.5); 5.5667 (1.6); 5.5645 (0.8); 5.5622 (0.6); 5.5592 (0.8); 5.5565 (1.1); 5.5543 (1.2); 5.5516 (1.0); 5.5488 (0.5); 5.5465 (0.6); 5.5440 (1.3); 5.5413 (1.2); 5.5386 (0.6); 5.5362 (0.5); 5.5336 (0.8); 5.5310 (0.6); 5.2978 (1.4); 5.2823 (2.3); 5.2555 (2.1); 5.2414 (2.8); 5.2265 (1.1); 3.8280 (1.5); 3.8173 (1.6); 3.7020 (4.1); 3.6918 (4.1); 3.6910 (4.1); 3.0713 (1.9); 3.0585 (2.0); 3.0457 (2.1); 3.0329 (2.1); 2.5529 (1.5); 2.5376 (1.7); 2.5273 (1.4); 2.5121 (1.5); 2.3248 (0.4); 2.3082 (0.8); 2.2956 (20.5); 2.2820 (2.0); 2.2705 (1.3); 2.2688 (1.3); 2.2556 (0.7); 1.7030 (6.9); 1.7007 (7.1); 1.6922 (7.0); 1.6900 (7.0); 1.6044 (2.3); 1.6033 (2.3); 1.6020 (2.2); 1.5931 (2.5); 1.5920 (2.4); 1.5907 (2.6); 1.5848 (6.4); 1.5656 (13.7); 1.5493 (50.0); 1.2958 (15.8); 1.2846 (15.7); 1.2549 (0.4); 0.0698 (0.5); 0.0053 (0.7); -0.0001 (24.1); -0.0056 (0.9)</p>
<p>1.91: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.2461 (0.8); 8.2340 (2.2); 7.2589 (38.9); 7.0923 (1.5); 7.0733 (2.5); 7.0536 (2.6); 7.0186 (1.9); 6.9996 (1.2); 5.7079 (0.5); 5.6855 (0.9); 5.6698 (1.0); 5.6233 (0.5); 5.6202 (0.5); 5.6072 (0.9); 5.5929 (0.6); 5.5892 (0.6); 5.2808 (0.6); 5.2583 (1.2); 5.2365 (0.8); 5.1413 (1.0); 5.1194 (0.7); 4.5724 (0.9); 4.5560 (2.0); 4.5399 (1.7); 4.5236 (0.5); 3.9714 (0.7); 3.9549 (0.7); 3.8641 (0.8); 3.8611 (0.8); 3.8498 (0.8); 3.8470 (0.8); 3.8105 (0.8); 3.8081 (0.9); 3.7939 (0.9); 3.7917 (0.9); 3.0698 (0.8); 3.0507 (0.9); 3.0314 (1.0); 3.0122 (1.0); 2.5535 (0.8); 2.5302 (1.0); 2.5150 (0.7); 2.4921 (0.8); 2.3851 (4.3); 2.3729 (16.0); 2.3623 (1.5); 2.2906 (11.2); 2.2604 (0.9); 2.2416 (0.7); 1.7209 (3.9); 1.7184 (3.9); 1.7055 (3.9); 1.7027 (3.8); 1.6196 (1.0); 1.6041 (1.1); 1.5744 (0.7); 1.4805 (2.0); 1.4704 (7.3); 1.4643 (2.7); 1.4541 (7.2); 1.4334 (0.6); 1.2913 (6.0); 1.2887 (6.1); 1.2745 (6.4); 1.2719 (6.1); 1.2595 (1.4); 0.8817 (0.6); 0.0079 (0.8); -0.0002 (18.9); -0.0084 (0.9)</p>
<p>1.97: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.2579 (0.8); 7.5205 (0.7); 7.2617 (126.1); 7.2113 (0.6); 7.0870 (1.8); 7.0676 (3.0); 7.0149 (3.5); 6.9975 (2.8); 5.2395 (1.0); 3.7098 (16.0); 3.6994 (5.7); 3.0617 (1.4); 3.0424 (1.4); 3.0233 (1.5); 3.0040 (1.4); 2.7935 (0.7); 2.7540 (0.6); 2.6102 (15.7); 2.5436 (0.9); 2.5201 (1.1); 2.5040 (0.8); 2.4807 (0.9); 2.2834 (12.3); 2.2556 (1.1); 2.2364 (0.9); 2.0474 (1.6); 1.5948 (2.4); 1.5690 (4.9); 1.2606 (5.9); 0.8986 (1.2); 0.8819 (3.9); 0.8642 (1.6); 0.0080 (1.9); -0.0002 (66.7); -0.0084 (2.8)</p>
<p>1.83: ¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃): δ= 7.75 (1.5); 7.73 (1.1); 7.55 (0.8); 7.53 (1.0); 3.89 (15.9); 3.16 (0.5); 3.14 (0.7); 3.06 (0.7); 2.63 (0.5); 2.60 (3.0); 2.51 (1.1); 2.375 (1.05); 2.37 (1.05); 1.84 (6.1)</p>

B. Formulierungsbeispiele

Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25
5 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 64 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoymethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20
10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykolether (®Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277° C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- d) Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen
15 oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.
- e) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten indem man
75 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze,
10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Calcium,
5 Gew.-Teile Natriumlaurylsulfat,
20 3 Gew.-Teile Polyvinylalkohol und
7 Gew.-Teile Kaolin
mischt, auf einer Stiftmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.
- f) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man
25 25 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze,
5 Gew.-Teile 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium
2 Gew.-Teile oleoymethyltaurinsaures Natrium,

1 Gew.-Teil Polyvinylalkohol,

17 Gew.-Teile Calciumcarbonat und

50 Gew.-Teile Wasser

auf einer Kolloidmühle homogenisiert und vorzerkleinert, anschließend auf einer Perlmühle mahlt und
5 die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.

C. Biologische Beispiele

Versuchsbeschreibung

10 1. Herbizide Wirkung bzw. Kulturpflanzenverträglichkeit im Voraufbau

Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut und Kulturpflanzen werden in Kunststoff- oder
Holzfasertöpfen ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als
Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wässrige
15 Suspension bzw. Emulsion unter Zusatz von 0,5% Additiv mit einer Wasseraufwandmenge von
umgerechnet 600 l/ha auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert.

Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten
Wachstumsbedingungen für die Testpflanzen gehalten. Nach ca. 3 Wochen wird die Wirkung der
20 Präparate visuell im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen in Prozentwerten bonitiert. Beispielsweise
bedeutet 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0% Wirkung = wie Kontrollpflanzen.

In den nachfolgenden Tabellen werden folgende Abkürzungen verwendet:

25 Unerwünschte Pflanzen / Weeds:

ABUTH:	<i>Abutilon theophrasti</i>	ALOMY:	<i>Alopecurus myosuroides</i>
AMARE:	<i>Amaranthus retroflexus</i>	AVEFA:	<i>Avena fatua</i>
ECHCG:	<i>Echinochloa crus-galli</i>	HORMU:	<i>Hordeum murinum</i>
LOLRI:	<i>Lolium rigidum</i>	MATIN:	<i>Matricaria inodora</i>
PHBPU:	<i>Ipomoea purpurea</i>	POLCO:	<i>Polygonum convolvulus</i>
SETVI:	<i>Setaria viridis</i>	STEME:	<i>Stellaria media</i>
VERPE:	<i>Veronica persica</i>	VIOTR:	<i>Viola tricolor</i>

Tabelle 6: Voraufbauwirksamkeit (Herbizide Wirkung gegen [%])

Beispielnummer	Dosierung	ALOMY	AVEFA	ECHCG	LOLRI	SETVI	ABUTH	AMARE	MATIN	PHBPU	POLCO	STEME	VIOTR	VERPE	HORMU
1.4	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.53	320	100	100	100	90	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.5	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.57	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.55	320	90	100	100	100	100	100	100	100	90	100	100	100	100	100
1.61	320	100	80	100	100	100	100	100	100	90	100	100	100	100	100
1.24	320	100	100	100	100	100	100	100	100	90	100	100	100	100	100
1.54	320	100	80	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.48	320	100	90	100	100	100	100	100	100	90	100	100	100	100	100
1.63	320	100	90	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	90
1.14	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.15	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.31	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.50	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	90
1.18	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.43	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.51	320	100	80	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	90
1.52	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.6	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.7	320	100	90	100	100	100	100	100	100	80	100	100	100	100	100
1.8	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.22	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.11	320	100	100	100	100	100	100	100	100	80	100	100	100	100	100
1.10	320	100	100	100	100	100	100	100	100	80	100	100	100	100	100
1.12	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.13	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.17	320	100	100	100	100	100	100	100	100	80	100	100	100	100	100
1.23	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	80
1.20	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100

Tabelle 7: Voraufbauwirksamkeit (Herbizide Wirkung gegen [%])

Beispielnummer	Dosierung	AMARE	MATIN	POLCO	VIOTR	VERPE
1.58	320	100	100	100	100	100
1.38	320	100	100	100	100	100
1.30	320	100	100	100	100	100
1.16	320	100	100	100	100	100
1.19	320	100	100	100	100	100
1.27	320	100	100	100	100	100
1.25	320	100	100	100	100	100
1.49	320	100	100	100	100	100
1.41	320	100	100	100	100	100
1.28	320	100	100	100	100	100
1.21	320	100	100	100	100	100
1.44	320	100	100	100	100	100
1.9	320	100	100	100	100	100
1.26	320	100	100	100	100	100
1.2	320	100	100	100	100	100
1.3	320	100	100	80	100	100
1.47	320	100	100	100	100	100

- 5 Wie die Ergebnisse zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen aus der Tabelle 6 und der Tabelle 7, bei Behandlung im Voraufbau eine gute herbizide Wirksamkeit gegen Schadpflanzen auf.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen haben im Voraufbauverfahren eine sehr gute Wirkung (80% bis 100% herbizide Wirkung) gegen Schadpflanzen wie zum Beispiel

- 10 *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Echinochloa crus-galli*, *Hordeum murinum*, *Lolium rigidum*, *Matricaria inodora*, *Ipomoea purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica persica* und *Viola tricolor* bei einer Aufwandmenge von 0.32 kg Aktivsubstanz oder weniger pro Hektar. Gleichzeitig lassen
- 15 Reis im Voraufbauverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen praktisch ungeschädigt. Einige Substanzen schonen darüber hinaus auch zweikeimblättrige Kulturen wie Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben oder Kartoffeln.

- Die erfindungsgemäßen Verbindungen zeigen teilweise eine hohe Selektivität und eignen sich deshalb
- 20 im Voraufbauverfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen.

2. Herbizide Wirkung bzw. Kulturpflanzenverträglichkeit im Nachauflauf

Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut- bzw. Kulturpflanzen werden in Kunststoff- oder Holzfasertöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter kontrollierten Wachstumsbedingungen angezogen. 2 bis 3 Wochen nach der Aussaat werden die

- 5 Versuchspflanzen im Einblattstadium behandelt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wässrige Suspension bzw. Emulsion unter Zusatz von 0,5% Additiv mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 l/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprüht. Nach ca. 3 Wochen Standzeit der
- 10 Versuchspflanzen im Gewächshaus, unter optimalen Wachstumsbedingungen, wird die Wirkung der Präparate visuell im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert. Beispielsweise bedeutet 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0% Wirkung = wie Kontrollpflanzen.

Tabelle 8: Nachauflaufwirksamkeit (Herbizide Wirkung gegen [%])

Beispielnummer	Dosierung	ECHCG	SETVI	ABUTH	AMARE	STEME	VIOTR	VERPE
1.31	320	100	90	90	100	100	90	90
1.57	320	100	90	90	100	90	90	90
1.12	320	100	100	90	90	100	80	90
1.5	320	100	90	100	100	100	90	90
1.55	320	100	100	90	90	90	90	90
1.14	320	100	90	90	100	100	90	90
1.43	320	100	90	90	90	100	90	90
1.52	320	100	80	90	90	100	90	90
1.50	320	100	90	80	90	100	90	90
1.6	320	100	100	90	100	100	90	80
1.7	320	100	100	80	100	100	90	90
1.8	320	100	100	90	100	100	90	90
1.48	320	100	90	80	90	90	80	90
1.11	320	100	100	90	100	100	90	90
1.18	320	100	90	90	90	100	90	100
1.63	320	100	100	90	100	90	90	90
1.15	320	100	80	90	90	100	80	90
1.10	320	100	80	90	90	100	90	90
1.38	320	100	90	90	100	100	90	90
1.2	320	100	90	80	100	100	80	90
1.54	320	100	80	80	90	90	90	90
1.58	320	100	90	90	90	90	90	90
1.24	320	100	90	90	90	100	90	90
1.30	320	100	90	90	100	100	90	80
1.22	320	100	100	90	90	90	90	90

Tabelle 9: Nachauflaufwirksamkeit (Herbizide Wirkung gegen [%])

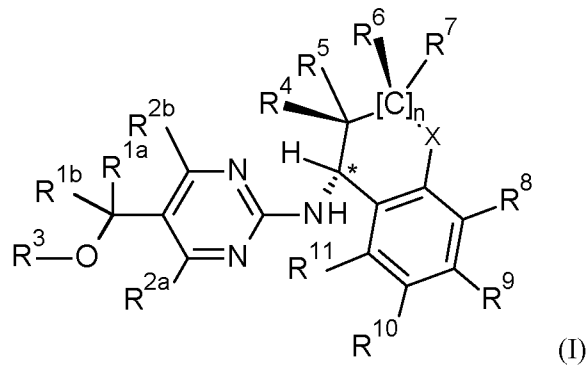
Beispielnummer	Dosierung	ECHCG	ABUTH	AMARE	STEME
1.13	320	100	80	90	90
1.4	320	90	90	100	90
1.53	320	100	90	90	90
1.61	320	100	90	90	90
1.22	320	100	90	90	90
1.20	320	100	90	90	100
1.49	320	80	80	90	90
1.17	320	80	90	80	100

Wie die Ergebnisse zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen aus der Tabelle 8 und Tabelle 5 9, bei Behandlung im Nachauflauf eine gute herbizide Wirksamkeit gegen Schadpflanzen auf.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen haben im Nachauflaufverfahren eine sehr gute herbizide Wirkung (80% bis 100% herbizide Wirkung) gegen Schadpflanzen wie zum Beispiel *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Echinochloa crus-galli*, *Hordeum murinum*, *Lolium rigidum*, *Matricaria inodora*, *Ipomoea purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica persica* und *Viola tricolor* bei einer Aufwandmenge von 0.32 kg Aktivsubstanz oder weniger pro Hektar. Gleichzeitig lassen erfindungsgemäße Verbindungen Gramineenkulturen wie Gerste, Weizen, Roggen, Hirse, Mais oder Reis im Nachauflaufverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen praktisch ungeschädigt. Einige Substanzen schonen darüber hinaus auch zweikeimblättrige Kulturen wie Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben oder Kartoffeln. Die 10 15 erfindungsgemäßen Verbindungen zeigen teilweise eine hohe Selektivität und eignen sich deshalb im Nachauflaufverfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen.

Patentansprüche

1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



5

und deren agrochemisch verträglichen Salze, in welchen

R^{1a} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff, Cyano, $C(O)OH$, $C(O)NH_2$;
- (C_1-C_6) -Alkyl, (C_1-C_6) -Halogenalkyl, (C_1-C_6) -Alkylcarbonyl- (C_1-C_4) -alkyl;
- 10 - (C_1-C_6) -Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -Haloalkoxy-carbonyl- (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_6) -halogenalkyl, (C_1-C_6) -Halogenalkoxy-carbonyl- (C_1-C_6) -halogenalkyl;
- (C_2-C_6) -Alkenyl, (C_2-C_6) -Halogenalkenyl;
- (C_2-C_6) -Alkynyl, (C_2-C_6) -Halogenalkynyl;
- (C_6-C_{14}) -Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C_1-C_6) -Alkyl und/oder (C_1-C_6) -Haloalkyl
- 15 substituiert sein können;
- Pyridyl, welche jeweils mit Halogen, (C_1-C_6) -Alkyl und/oder (C_1-C_6) -Haloalkyl substituiert sein können;
- Thienyl, welche jeweils mit Halogen, (C_1-C_6) -Alkyl und/oder (C_1-C_6) -Haloalkyl substituiert sein können;
- 20 - (C_6-C_{14}) -Aryl- (C_1-C_6) -alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C_1-C_6) -Alkyl und/oder $(C_1-$

C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;

- Aminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch
5 (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, Amino-(C₁-C₆)-alkyl, Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
- 10 - (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- 15 R^{1b} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus
 - Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂;
 - (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;
 - (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- 20 - (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl;
- (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinyl;
- (C₆-C₁₄)-Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- Pyridyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein
25 können;
- Thienyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;

- (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- Aminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl;
- 5 - (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- 10 - Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, Amino-(C₁-C₆)-alkyl, Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- 15

wobei, falls R^{1a} ungleich Wasserstoff ist, R^{1a} mit R^{1b} über eine Bindung miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff, an dem diese beiden Reste gebunden sind, ein gesättigter oder ungesättigter 3 bis 7 gliedriger Carbo- oder Heterocyclus entsteht, der unsubstituiert ist oder substituiert ist mit einem oder mehreren Substituenten ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, spiro-(C₃-C₆)-Cycloalkyl;

R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂;
- (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)-Halogenalkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;
- 25 - (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Halogenalkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl, (C₂-C₆)-Alkenylcarbonyl, (C₂-C₆)-Haloalkenyl-

- carbonyl, (C₂-C₆)-Alkenyloxy, (C₂-C₆)-Haloalkenyloxy, (C₂-C₆)-Alkenyloxycarbonyl, (C₂-C₆)-Haloalkenyloxycarbonyl;
- (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl, (C₂-C₆)-Alkynylcarbonyl, (C₂-C₆)-Haloalkynylcarbonyl, (C₂-C₆)-Alkinyloxy, (C₂-C₆)-Haloalkinyloxy, (C₂-C₆)-Alkinyloxycarbonyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinyloxycarbonyl; Tri-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl, Di-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl, Mono-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl; Phenylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl;
- 5 - (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₆-C₁₄)-Aryloxy, (C₆-C₁₄)-Arylcarbonyl und (C₆-C₁₄)-Aryloxycarbonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- 10 - (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl-carbonyl, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl-carbonyloxy, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyloxy;
- Aminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, Di-(C₁-C₆)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl;
- N-((C₁-C₆)-Haloalkanoyl)-amino-carbonyl, Mono-((C₆-C₁₄)-aryl)-amino-carbonyl, Di-((C₆-C₁₄)-aryl)-amino-carbonyl;
- 15 - (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy;
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert ist; (C₃-C₈)-Cycloalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy;
- 20 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy;
- 25 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy;
- 30 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyloxy;

C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkylcarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkoxycarbonyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyloxy;

- Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, Hydroxy-(C₁-C₆)-alkoxy, Cyano-(C₁-C₆)-alkoxy, Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
- 5 - (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Alkylthio, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Halogenalkylthio, (C₁-C₆)-Halogenalkylsulfinyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)-Halogenalkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)-Alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)-Alkylthiocarbonyloxy, (C₁-C₆)-Haloalkylthiocarbonyloxy, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy; (C₄-C₁₄)-Arylsulfonyl, (C₆-C₁₄)-Arylthio, (C₆-C₁₄)-Arylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₃-C₈)-Alkenylthio, (C₃-C₈)-Cycloalkenylthio und (C₃-C₆)-Alkinylthio;
- 10
- 15

R³ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff;
- 20 - (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylcarbonyl;
- (C₂-C₆)-Alkenylcarbonyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenylcarbonyl;
- (C₂-C₆)-Alkinylcarbonyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinylcarbonyl;
- (C₆-C₁₄)-Arylcarbonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- 25 - Aminocarbonyl, [(C₁-C₆)-Alkylamino]carbonyl, [Di-(C₁-C₆)-Alkylamino]carbonyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl, (C₂-C₆)-Alkenyloxycarbonyl, (C₂-C₆)-Alkinyloxycarbonyl;
- (C₁-C₆)-Trialkylsilyl;
- (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl;

- (C₆-C₁₄)-Arylsulfonyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;
- (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl;
- 5 - (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl; Tri-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl, Di-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl, Mono-(C₁-C₆)-alkylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl; Phenylsilyl-(C₂-C₆)-alkynyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl;
- (C₆-C₁₄)-Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- 10 - (C₂-C₁₄)-Het-Aryl, welche jeweils am Het-Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- 15 - Aminocarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann;
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- 20 - (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-halogenalkyl, Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylthio-(C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- 25

- R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, Hydroxy, (C₁-C₆)-Alkoxy und (C₁-C₆)-Halogenalkoxy; oder
- 5 die Reste R⁴ und R⁵ bilden zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an welchem sie gebunden sind, einen drei- bis siebengliedrigen Ring;
- R⁶ und R⁷ jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Halogenalkoxy, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₆-C₁₄)-Aryloxy, (C₆-C₁₄)-Arylcarbonyl und (C₆-C₁₄)-Aryloxycarbonyl; oder
- 10 die Reste R⁶ und R⁷ bilden zusammen eine (C₁-C₇)-Alkylengruppe, die ein oder mehrere Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthalten kann, wobei die (C₁-C₇)-Alkylengruppe durch Halogen einfach oder mehrfach substituiert sein kann und die jeweiligen Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können;
- n die Laufzahl 0, 1 oder 2 ist;
- 15 R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₆)-Alkyloxycarbonyl, (C₁-C₆)-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)-di-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Halogenalkoxy, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl, (C₂-C₆)-Alkynylcarbonyl, (C₂-C₆)-Haloalkynylcarbonyl, (C₂-C₆)-Alkinyloxy, (C₂-C₆)-Haloalkinyloxy, (C₂-C₆)-Alkinyloxycarbonyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinyloxycarbonyl, (C₆-C₁₄)-Aryl und Nitro, wobei die Reste R⁹ und R¹⁰ ringbildend durch eine -O-CH₂-O- Gruppe verbunden sein können;
- 20
- X für eine Bindung, CH₂, O, S, Carbonyl, NH, CR¹²R¹³, NR¹⁴, CH₂O oder CH₂S steht, wobei bei den beiden letztgenannten Gruppen das Kohlenstoffatom an den aromatischen Teil und das Heteroatom O oder S an den teilhydrierten Teil des Amins gebunden ist;
- 25
- R¹² und R¹³ jeweils unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl und (C₁-C₆)-Haloalkyl; und
- R¹⁴ ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl und (C₁-C₆)-Haloalkyl.

2. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

R^{1a} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff, Cyano;
- (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinyl,
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann,

und dass

R^{1b} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Cyano, C(O)OH, C(O)NH₂;
- (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₁-C₆)-Alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl;
- (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkinyl;
- (C₆-C₁₄)-Aryl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- Pyridyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- Thienyl, welche jeweils mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können;
- (C₆-C₁₄)-Aryl-(C₁-C₆)-alkyl, welche jeweils am Arylteil mit Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl und/oder (C₁-C₆)-Haloalkyl substituiert sein können
- (C₃-C₈)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert sein kann; (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl;
- (C₃-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₆)-

halogenalkyl;

- Cyano-(C₁-C₆)-alkyl;
- (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl.

5

3. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

R^{1a} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Wasserstoff;
- (C₁-C₃)-Alkyl, (C₁-C₃)-Halogenalkyl, (C₂-C₃)-Alkenyl, (C₂-C₃)-Alkynyl,

10

und dass

R^{1b} ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus

- Cyano;
- (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Halogenalkyl;
- (C₁-C₃)-Alkoxy-carbonylmethyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Halogenalkenyl;
- 15 - (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₂-C₄)-Halogenalkynyl;
- Phenyl, welche am Arylteil mit Halogen und/oder Methyl substituiert sein kann;
- CH₂Phenyl (Benzyl), welches am Arylteil mit Halogen und/oder Methyl substituiert sein kann;
- (C₃-C₆)-Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder einfach oder mehrfach am Cycloalkylrest
20 durch Methyl und/oder Halogen substituiert sein kann.

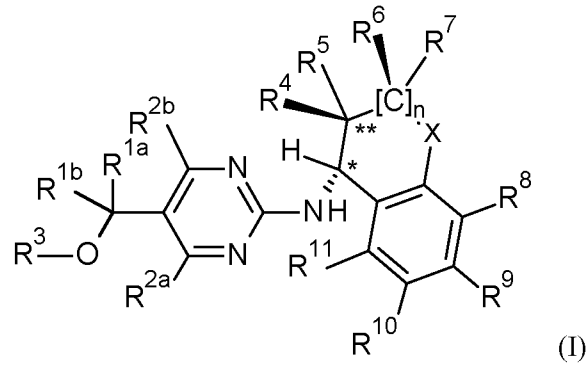
4. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, dass R^{1a} mit R^{1b}, im Falle dass R^{1a} ungleich Wasserstoff bedeutet, über eine Bindung miteinander verbunden sind, so dass zusammen mit dem Kohlenstoff an dem diese beiden Reste

gebunden sind ein gesättigter 3 bis 6 gliedriger Carbocyclus entsteht, der unsubstituiert ist oder substituiert ist mit einem oder mehreren Substituenten ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Methyl, Trifluormethyl, Cyclopropyl;

5. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass R^{2a} und R^{2b} jeweils unabhängig voneinander ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl und (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-haloalkyl, wobei der Cycloalkylrest jeweils unsubstituiert ist oder durch (C₁-C₆)-Alkyl und/oder Halogen substituiert ist.
- 10 6. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass der R^3 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, Phenylcarbonyl (Benzoyl), (C₁-C₃)-Alkyl, CH₂(C₂-C₃)-Alkenyl, CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkenyl, CH₂(C₂-C₃)-Alkynyl, CH(CH₃)(C₂-C₃)-Alkynyl, (C₁-C₃)-Alkoxy-carbonylmethyl, CH₂Phenyl (Benzyl), CH₂(4-F-Phenyl) und Si(CH₃)₃.
- 15 7. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass der R^3 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH=CH₂, CH₂C(CH₃)=CH₂, CH₂CH=CHCH₃, CH₂C≡CH, CH₂C≡CCH₃, CH(CH₃)CH=CH₂, CH(CH₃)C≡CH, und CH₂C(O)OCH₃.
- 20 8. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass R^4 und R^5 jeweils unabhängig voneinander ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus bestehend aus Wasserstoff, Hydroxy, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkylphenyl und (C₁-C₆)-Alkoxy.
- 25 9. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, dass R^6 und R^7 unabhängig voneinander, ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl und (C₆-C₁₄)-Aryl.
10. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, dass R^8 ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Wasserstoff, Halogen, Cyano, C(O)OH, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Alkyloxycarbonyl, und (C₆-C₁₄)-Aryl.

nach einem der Ansprüche 1 bis 16, dadurch gekennzeichnet, dass das chirale Kohlenstoffatom mit der Kennzeichnung (*) eine (R)-Konfiguration aufweist.

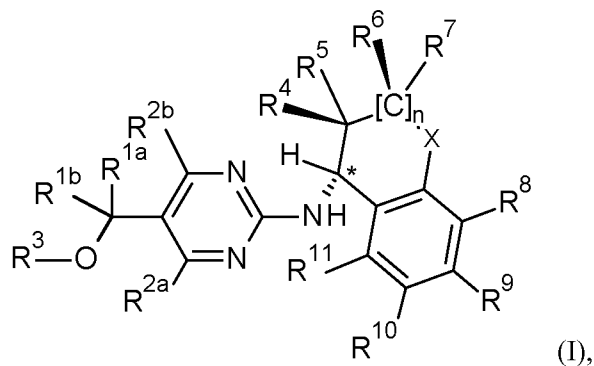
18. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



5 nach einem der Ansprüche 1 bis 16, dadurch gekennzeichnet, dass das chirale Kohlenstoffatom mit der Kennzeichnung (*) eine (R)-Konfiguration und das chirale Kohlenstoffatom mit der Kennzeichnung (**) eine (S)-Konfiguration aufweist.

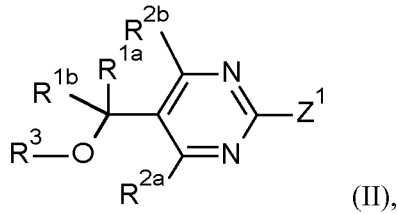
19. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren agrochemisch verträgliche Salze und/oder deren agrochemisch verträgliche quaternierte Stickstoff-

10 Derivate



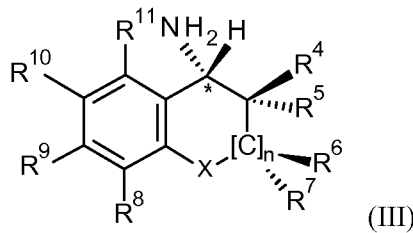
wobei die Reste R^{1a} bis R¹¹ sowie X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind,
und wobei

eine Verbindung der allgemeinen Formel (II)



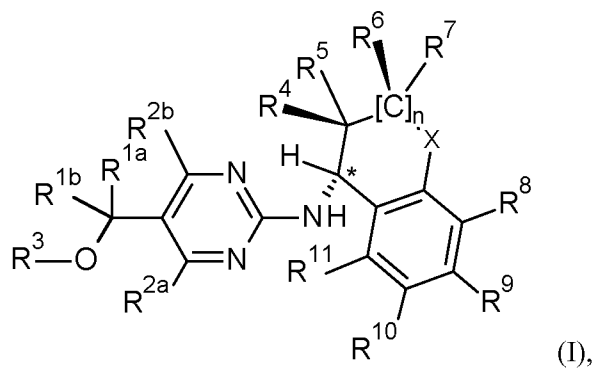
wobei R^{1a} , R^{1b} , R^{2a} , R^{2b} und R^3 gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind, und Z^1 für einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe steht, ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Fluor, Chlor, Brom, Jod, ein (C₁-C₄)-Alkylsulfanyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, ein unsubstituiertes oder einfach oder mehrfach mit Fluor, Chlor, Brom oder (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkylsulfonyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylphenyl-sulfonyl,

umgesetzt wird mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder mit einem Säureadditionssalz desamins der allgemeinen Formel (III)

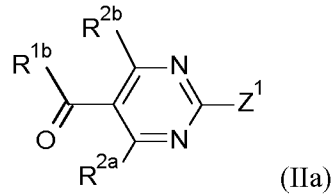


wobei die Reste R^4 bis R^{11} sowie X und n wie in einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind.

20. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren agrochemisch verträgliche Salze und/oder deren agrochemisch verträgliche quaternierte Stickstoff-Derivate

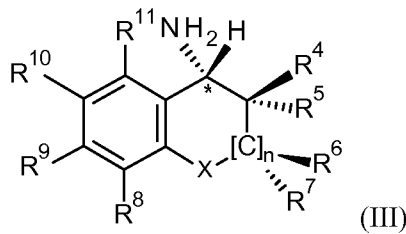


wobei die Reste R^1 bis R^{11} sowie X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind, durch Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (IIa)



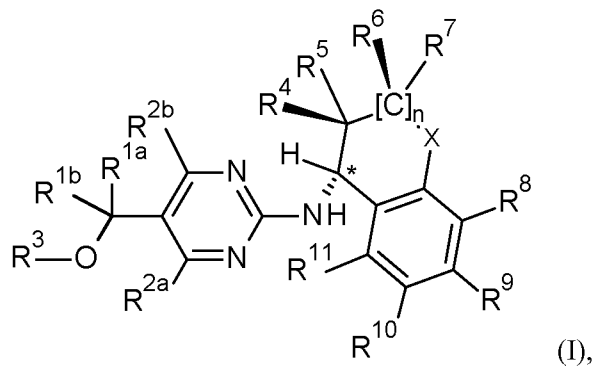
5 worin R^{1b} und R^{2a} sowie R^{2b} gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind und Z¹ für einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe, ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Fluor, Chlor, Brom, Jod, ein (C₁-C₄)-Alkylsulfanyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, ein unsubstituiertes oder ein substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkylsulfonyl oder ein (C₁-C₄)-Alkylphenyl-sulfonyl, steht,

mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz desamins der allgemeinen Formel (III)

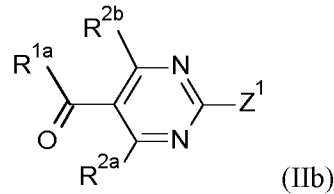


10 wobei die Reste R⁴ bis R¹¹, X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 17 definiert sind und abschließende Reduktion der Ketogruppe oder abschließende Umsetzung der Ketogruppe mit Kohlenstoff-Nucleophilen zu Verbindungen der Formel (I) mit R³ gleich Wasserstoff.

15 21. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren agrochemisch verträgliche Salze und/oder deren agrochemisch verträgliche quaternierte Stickstoff-Derivate



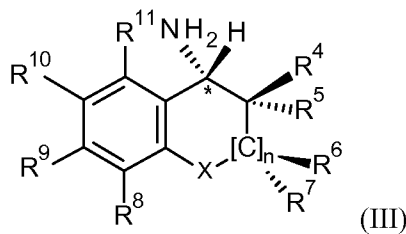
worin die Reste R^{1a} bis R¹¹ sowie X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind, durch Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (IIb)



worin R^{1a} und R^{2a} sowie R^{2b} gemäß einem der Ansprüche 1 bis 17 definiert sind und Z^1 für einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe steht,

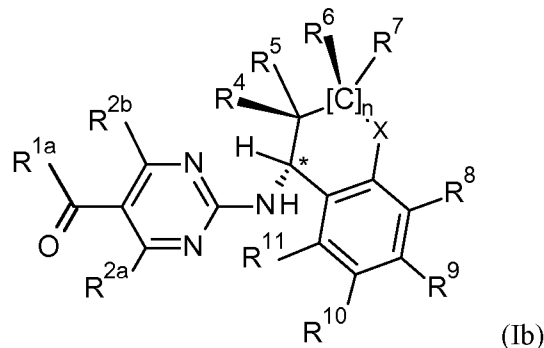
mit einem Amin der allgemeinen Formel (III) oder einem Säureadditionssalz desamins der allgemeinen

5 Formel (III)



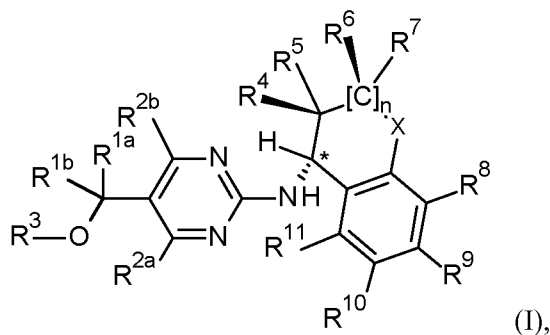
wobei die Reste R^4 bis R^{11} , X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind,

zu 2-Amino-5-Keto-Pyrimidinderivaten der Formel (Ib)



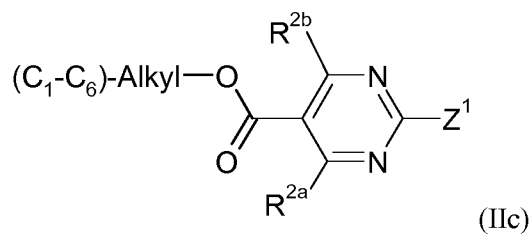
10 wobei die Reste R^{1a} bis R^{11} sowie X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind, und abschließende Umsetzung der Ketogruppe mit Kohlenstoff-Nucleophilen zu Verbindungen der Formel (I) mit R^3 gleich Wasserstoff.

22. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), wobei die Reste R^1 bis
15 R^{11} sowie X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 definiert sind und/oder deren agrochemisch verträgliche Salze und/oder deren agrochemisch verträgliche quaternierte Stickstoff-Derivate



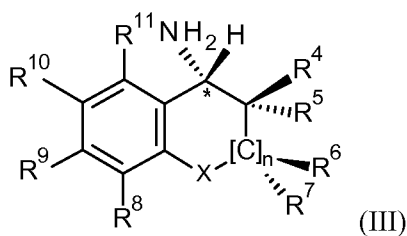
worin die Reste R^{1a} bis R^{11} sowie X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 17 definiert sind,

durch Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (IIc)

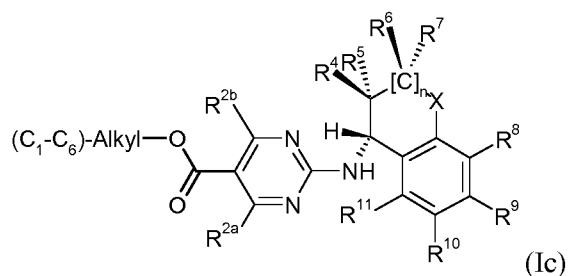


- 5 worin R^{2a} und R^{2b} gemäß einem der Ansprüche 1 bis 17 definiert sind und Z^1 für einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe steht,

mit einem Amin der Formel (III) oder einem Säureadditionssalz einesamins der Formel (III)



- 10 wobei die Reste R^4 bis R^{11} , X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 17 definiert sind zu einem Intermediat der Formel (Ic)



wobei die Reste R^{2a} bis R^{11} sowie X und n gemäß einem der Ansprüche 1 bis 17 definiert sind, und abschließende Umsetzung der Estergruppe mit Kohlenstoff-Nucleophilen zu Verbindungen der Formel (I), worin $R^{1a} = R^{1b}$ und R^3 gleich Wasserstoff.

- 5 23. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und/oder deren agrochemisch verträglichen Salze und/oder deren agrochemisch verträglichen quaternierten Stickstoff-Derivate nach einem der Ansprüche 19 bis 21, dadurch gekennzeichnet, dass in Verbindungen der Formel (I), in denen R^3 für Wasserstoff steht, R^3 durch Reaktionen vom Typ einer Alkylierung oder einer Acylierung in eine Verbindung der Formel (I) mit R^3 ungleich Wasserstoffübergeführt wird,
10 wobei R^3 gemäß einem der Ansprüche 1 bis 17 definiert ist.
24. Herbizides Mittel oder pflanzenwachstumsregulierendes Mittel, dadurch gekennzeichnet, dass es eine oder mehrere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze nach einem oder
15 Ansprüche 1 bis 17 enthält.
25. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man eine wirksame Menge von einer oder mehreren Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salzen nach einem der Ansprüche 1 bis 17 auf Pflanzen,
20 Pflanzenteile, Pflanzensamen oder auf eine Anbaufläche appliziert.
26. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salzen nach einem der Ansprüche 1 bis 17 als Herbizide oder als Pflanzenwachstumsregulatoren.
27. Verwendung nach Anspruch 25, dadurch gekennzeichnet, dass die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von
25 Pflanzen in Kulturen von Nutz- oder Zierpflanzen eingesetzt werden.
28. Verwendung nach den Ansprüchen 25 oder 26, dadurch gekennzeichnet, dass die Kulturpflanzen transgene Kulturpflanzen sind.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2018/058081

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 INV. C07D405/12 C07D239/42 A01N43/50
 ADD.

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

B. FIELDS SEARCHED
 Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
 C07D A01N

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, 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.
Y	WO 2017/016914 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 2 February 2017 (2017-02-02) cited in the application examples 161,163-165 -----	1-28
Y	PAOLA CIAPETTI AND BRUNO GIETHLEN ED - CAMILLE GEORGES WERMUTH: "Chapter 15 - Molecular Variations Based on Isosteric Replacements", 1 January 2008 (2008-01-01), THE PRACTICE OF MEDICINAL CHEMISTRY (THIRD EDIT, ELSEVIER, NL, PAGE(S) 290 - 342, XP009142466, ISBN: 978-0-12-374194-3 page 298, left-hand column -----	1-28

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

Date of the actual completion of the international search 11 June 2018	Date of mailing of the international search report 19/06/2018
---	--

Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Grassi, Damian
--	--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2018/058081

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2017016914 A1	02-02-2017	AR 105460 A1	04-10-2017
		AU 2016299728 A1	15-02-2018
		CA 2993266 A1	02-02-2017
		CN 108026086 A	11-05-2018
		EP 3325472 A1	30-05-2018
		WO 2017016914 A1	02-02-2017

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2018/058081

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D405/12 C07D239/42 A01N43/50 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 2017/016914 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 2. Februar 2017 (2017-02-02) in der Anmeldung erwähnt Beispiele 161,163-165 -----	1-28
Y	PAOLA CIAPETTI AND BRUNO GIETHLEN ED - CAMILLE GEORGES WERMUTH: "Chapter 15 - Molecular Variations Based on Isosteric Replacements", 1. Januar 2008 (2008-01-01), THE PRACTICE OF MEDICINAL CHEMISTRY (THIRD EDIT, ELSEVIER, NL, PAGE(S) 290 - 342, XP009142466, ISBN: 978-0-12-374194-3 Seite 298, linke Spalte -----	1-28
<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 11. Juni 2018		Absendedatum des internationalen Recherchenberichts 19/06/2018
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Grassi, Damian

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2018/058081

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2017016914 A1	02-02-2017	AR 105460 A1	04-10-2017
		AU 2016299728 A1	15-02-2018
		CA 2993266 A1	02-02-2017
		CN 108026086 A	11-05-2018
		EP 3325472 A1	30-05-2018
		WO 2017016914 A1	02-02-2017
