



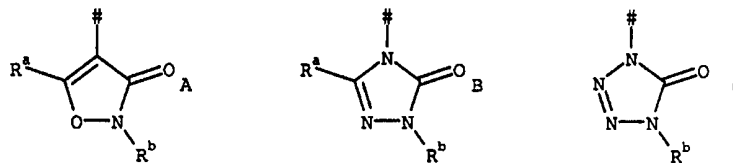
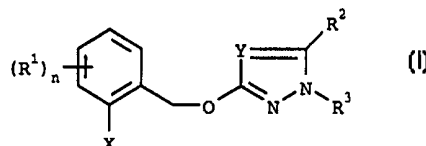
<p>(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 403/12, 413/12, A01N 43/647, 43/713, C07D 401/14</p>	<p>A1</p>	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 99/05139</p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 4. Februar 1999 (04.02.99)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP98/04096</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 2. Juli 1998 (02.07.98)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: 197 31 153.9 21. Juli 1997 (21.07.97) DE</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(72) Erfinder; und</p> <p>(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Jean-Ganss-Strasse 21, D-67227 Frankenthal (DE). SAUTER, Hubert [DE/DE]; Neckarpromenade 20, D-68167 Mannheim (DE). BAYER, Herbert [DE/DE]; D 3.4, D-68159 Mannheim (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestrasse 21, D-56288 Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE]; Borsigstrasse 5, D-67063 Ludwigshafen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Breslauer Strasse 6, D-67105 Schifferstadt (DE). GYPSE, Andreas [DE/DE]; B 4.4, D-68159 Mannheim (DE). PTOCK, Arne [DE/DE]; Eichenstrasse 23, D-67067 Ludwigshafen (DE). KIRSTGEN, Reinhard [DE/DE]; Karolinenstrasse 51, D-67434 Neustadt (DE). GÖTZ, Norbert [DE/DE]; Schöfferstrasse 25, D-67547 Worms</p>	<p>(DE). GÖTZ, Roland [DE/DE]; St.-Josefs-Gasse 18, D-67067 Ludwigshafen (DE). RÖHL, Franz [DE/DE]; Sebastian-Kneipp-Strasse 17, D-67105 Schifferstadt (DE). AMMERMANN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2, D-64646 Heppenheim (DE). HARRIES, Volker [DE/DE]; Immengärtenweg 29e, D-67227 Frankenthal (DE). LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, D-67434 Neustadt (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstrasse 9, D-67117 Limburgerhof (DE).</p> <p>(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(81) Bestimmungsstaaten: AL, AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, GE, HU, ID, IL, JP, KR, KZ, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht.</p>	

(54) Title: 2-[PYRAZOLYL AND TRIAZOLYL-3'-OXYMETHYLENE]-PHENYL-ISOXAZOLONES, TRIAZOLONES AND TETRAZOLONES AS PESTICIDES AND FUNGICIDES

(54) Bezeichnung: 2-[PYRAZOLYL- UND TRIAZOLYL-3'-OXYMETHYLEN]-PHENYL-ISOXAZOLONE, -TRIAZOLONE UND -TETRAZOLONE ALS PESTIZIDE UND FUNGIZIDE

(57) Abstract

The invention relates to 2-[pyrazolyl and triazolyl-3'-oxymethylene]-phenyl-isoxazolones, triazolones and tetrazolones of formula (I), wherein the indices and the substituents have the following meaning: X represents a group A, B or C, # indicating the bond with the phenyl ring, R^a being hydrogen, halogen, alkyl or alkoxy and R^b being alkyl; Y represents N or CR^c, R^c being hydrogen, halogen or alkyl; n represents 0, 1, 2, 3 or 4 and the substituents R¹ can be different when n is greater than 1; R¹ represents nitro, cyano or halogen, optionally substituted alkyl or optionally substituted alkoxy or if n is 2, additionally an optionally substituted bridge which is bound to two adjacent ring atoms, said bridge containing three to four members from the group of 3 or 4 carbon atoms, 2 to 3 carbon atoms and 1 or 2 nitrogen, oxygen and/or sulphur atoms, and together with the ring to which it is bound may form a partially unsaturated or aromatic radical; R² represents hydrogen, nitro, cyano, halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, alkylthio or alkoxy-carbonyl and R³ represents optionally substituted alkyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally substituted aryl or optionally substituted hetaryl.



(57) Zusammenfassung

2-[Pyrazolyl- und Triazolyl-3'-oxymethylen]-phenyl-isoxazolone, -triazolone und -tetrazolone der Formel (I), in der die Indices und die Substituenten die folgende Bedeutung haben: X eine Gruppe A, B oder C, wobei # die Bindung mit dem Phenylring kennzeichnet und R^a für Wasserstoff, Halogen, Alkyl oder Alkoxy und R^b für Alkyl steht; Y N oder CR^c, wobei R^c für Wasserstoff, Halogen oder Alkyl steht; n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist; R¹ Nitro, Cyano, Halogen, ggf. subst. Alkyl oder ggf. subst. Alkoxy oder für den Fall, daß n für 2 steht, zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 2 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring, an den sie gebunden ist, einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann; R² Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Alkoxy-carbonyl; R³ ggf. subst. Alkyl, ggf. subst. Cycloalkyl, ggf. subst. Aryl oder ggf. subst. Hetaryl.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

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

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

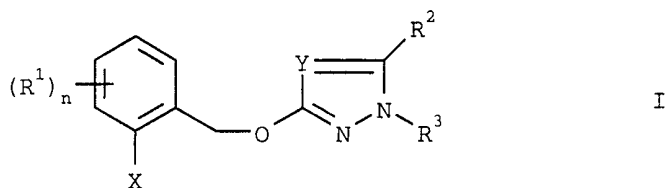
2-[PYRAZOLYL- UND TRIAZOLYL-3'-OXYMETHYLEN]-PHENYL-ISOXAZOLONE, -TRIAZOLONE UND -TETRAZOLONE ALS PESTIZIDE UND FUNGIZIDE

5

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 2-[Pyrazolyl- und Triazolyl-3'-oxymethylen]-phenyl-isoxazolone, -triazolone und -tetrazolone
 10 der Formel I

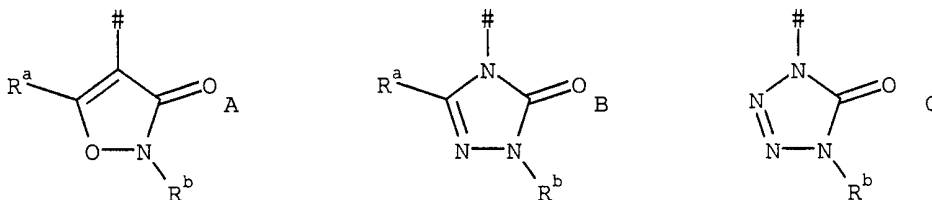
15



in der die Indices und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

20 X eine Gruppe A, B oder C,

25



wobei

30

die Bindung mit dem Phenylring kennzeichnet und

R^a für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy und

R^b für C₁-C₄-Alkyl steht;

35

Y N oder CR^c, wobei

R^c für Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl steht;

40 n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist;

R¹ Nitro, Cyano, Halogen,

45 ggf. subst. C₁-C₆-Alkyl oder ggf. subst. Alkoxy oder

für den Fall, daß n für 2 steht, zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 2 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;

5
R² Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl,
10 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

R³ ggf. subst. C₁-C₆-Alkyl, ggf. subst. C₃-C₆-Cycloalkyl, ggf. subst. Aryl oder ggf. subst. Hetaryl.

15

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen.

20 Aus WO-A 93/15046, WO-A 96/01256 und WO-A 96/01258 sind 2-[Pyrazolyl-4-oxymethylen]-anilide und 2-[Triazolyl-4-oxymethylen]-anilide zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und Schadpilzen bekannt.

25 4-Phenyl-2,3-dihydro-isoxazolone, 4-Phenyl-2,4-dihydro-triazolone und 2-Phenyl-2,5-dihydro-tetrazolone mit orthoständigem Substituenten an dem Phenylrest werden in WO-A 95/14009, WO-A 96/36229, WO-A 96/38425, WO-A 97/05120 und WO-A 97/02255 offenbart.

30 Der vorliegenden Erfindung lagen Verbindungen mit verbesserter Wirkung als Aufgabe zugrunde.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Desweiteren wurden Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthal-

35 tende Mischungen sowie Verfahren zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

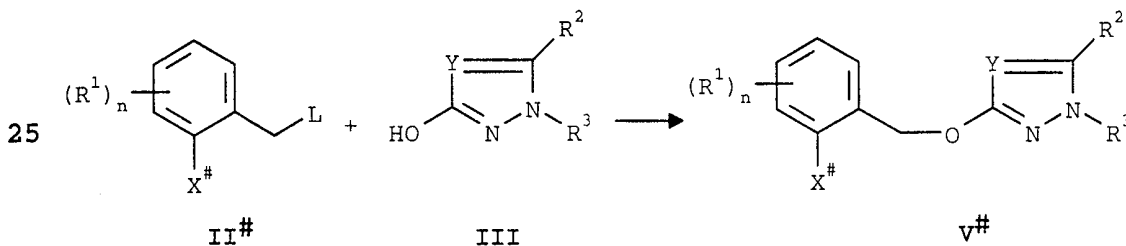
Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den
40 oben genannten Schriften WO-A 93/15046, WO-A 96/01256 und WO-A 96/01258 in dem Isoxazolone-, Triazolone- bzw. Tetrazolone-Rest am Phenylring und von den aus WO-A 95/14009, WO-A 96/36229, WO-A 96/38425, WO-A 97/05120 und WO-A 97/02255 bekannten Verbindungen in der Oxymethylen-Pyrazolyl-, bzw. -Triazolylgruppierung
45 am Phenylring. Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegen-

über den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schäd-
pilze und tierische Schädlinge auf.

Die Verbindungen der Formel I können an sich analog der in
5 WO-A 95/14009, WO-A 96/01256, WO-A 96/01258, WO-A 96/36229,
WO-A 96/38425, WO-A 97/05120 bzw. WO-A 97/02255 beschriebenen
Methoden erhalten werden.

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten wer-
10 den, wobei es für die Synthese unerheblich ist, ob zunächst die
Gruppe X oder die Pyrazolyl-, bzw. Triazolylgruppierung aufgebaut
wird. Zur besseren Übersichtlichkeit wird in den nachfolgenden
Reaktionsbeschreibungen daher die Bezeichnung X[#] für den Rest X,
bzw. eine geeignete Vorstufe dieses Restes und E[#] für die Pyrazo-
15 yl-, bzw. Triazolylgruppierung, bzw. eine geeignete Vorstufe da-
für verwendet.

Man erhält diejenigen Verbindungen I beispielsweise dadurch, daß
man ein Benzylderivat der Formel II[#] in Gegenwart einer Base mit
20 einem 3-Hydroxypyrazol oder -triazol der Formel III in das ent-
sprechende Phenylderivat der Formel V[#] überführt.



30 Sofern in der Formel V[#] der Rest X[#] für eine Gruppe A, B oder C
steht, entsprechen die Phenylverbindungen der Formel V[#] denen der
Formel I.

L in der Formel II bedeutet eine nucleophil austauschbare Gruppe,
beispielsweise Halogen (z.B. Chlor, Brom und Iod), oder ein Al-
35 kyl- oder Arylsulfonat (z.B. Methylsulfonat, Trifluormethylsulfo-
nat, Phenylsulfonat und 4-Methylphenylsulfonat).

Die Veretherung der Verbindungen II[#] und III wird üblicherweise
bei Temperaturen von 0°C bis 80°C, vorzugsweise bei 20°C bis 60°C,
40 durchgeführt.

Geeignete Lösungsmittel sind aromatische Kohlenwasserstoffe wie
Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie
Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethyl-
45 ether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol
und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril,
Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, i-Propanol, n-Butanol.

und tert.-Butanol, Ketone wie Aceton und Methylethylketon sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on und 1,2-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidin, vorzugsweise Methylenchlorid, Aceton, Toluol, Methyl-tert.-butyl-
5 ether und Dimethylformamid. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkali-
metall- und Erdalkalimetallhydroxide (z.B. Lithiumhydroxid,
10 Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid), Alkalime-
tall- und Erdalkalimetalloxide (z.B. Lithiumoxid, Natriumoxid,
Calciumoxid und Magnesiumoxid), Alkalimetall- und Erdalkalime-
tallhydride (z.B. Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und
Calciumhydrid), Alkalimetallamide (z.B. Lithiumamid, Natriumamid
15 und Kaliumamid), Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate (z.B.
Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat) sowie Alkalimetallhydrogen-
carbonate (z.B. Natriumhydrogencarbonat), metallorganische Ver-
bindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle (z.B. wie Methyl-
lithium, Butyllithium und Phenyllithium), Alkylmagnesiumhaloge-
20 nide (z.B. Methylmagnesiumchlorid) sowie Alkalimetall- und Erd-
alkalimetallalkoholate (z.B. Natriummethanolat, Natriumethanolat,
Kaliumethanolat, Kalium-tert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium),
außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin,
Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Py-
25 ridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dime-
thylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders
bevorzugt werden Natriumhydroxid, Kaliumcarbonat und Kalium-
tert.-butanolat. Die Basen werden im allgemeinen äquimolar, im
Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet.

30

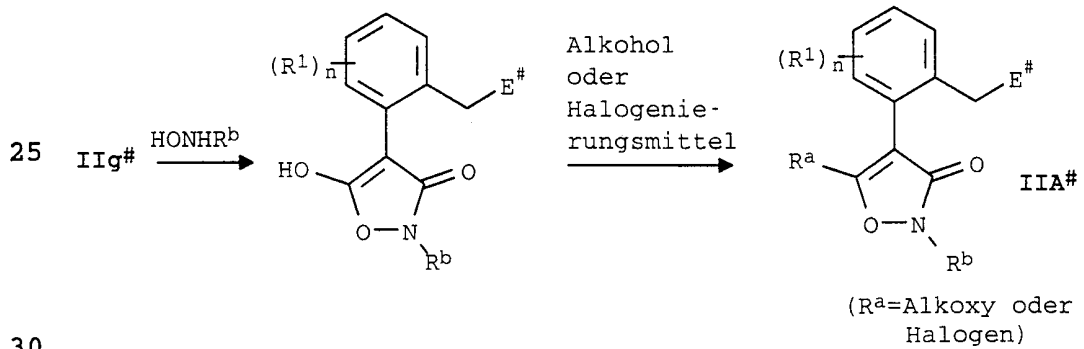
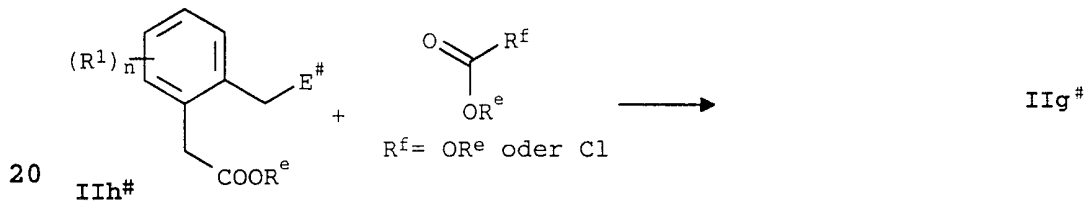
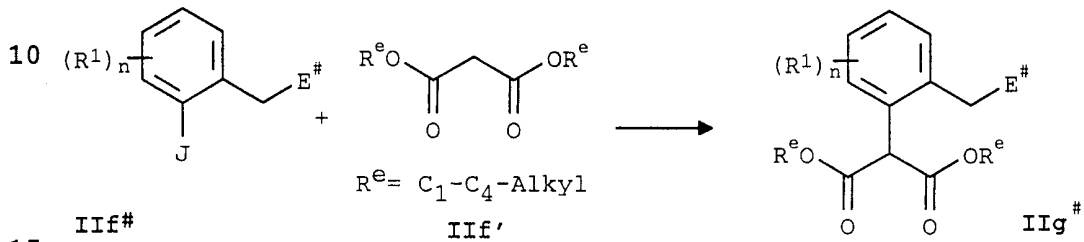
Es kann für die Umsetzung vorteilhaft sein, eine katalytische
Menge eines Kronenethers (z.B. 18-Krone-6 oder 15-Krone-5) zuzu-
setzen.

35 Die Umsetzung kann auch in Zweiphasensystemen bestehend aus einer
Lösung von Alkali- oder Erdalkalihydroxiden oder -carbonaten in
Wasser und einer organischen Phase (z.B. aromatische und/oder
halogenierte Kohlenwasserstoffe) durchgeführt werden. Als Phasen-
transferkatalysatoren kommen hierbei beispielsweise Ammoniumhalo-
40 genide und -tetrafluoroborate (z.B. Benzyltriethylammoniumchlorid,
Benzyltributylammoniumbromid, Tetrabutylammoniumchlorid, He-
xadecyltrimethylammoniumbromid oder Terabutylammoniumtetrafluoro-
borat) sowie Phosphoniumhalogenide (z.B. Tetrabutylphosphonium-
chlorid und Tetraphenylphosphoniumbromid) in Betracht.

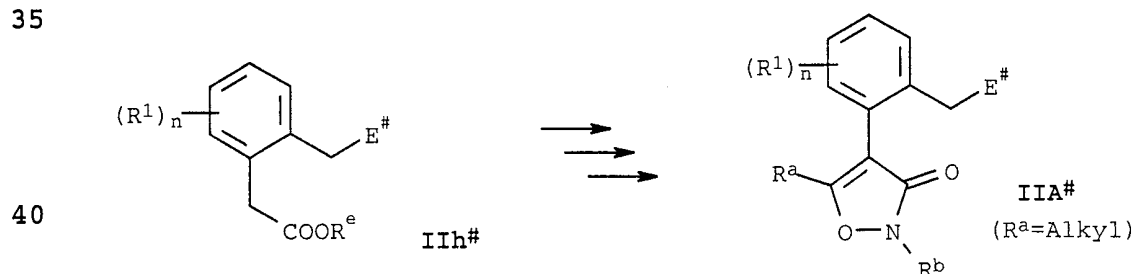
45

Es kann für die Umsetzung vorteilhaft sein, zunächst das 3-Hydroxypyrazol mit der Base in das entsprechende Hydroxylat umzusetzen, welches dann mit dem Benzylderivat umgesetzt wird.

5 Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Benzylverbindungen II[#] sind aus der Literatur bekannt [vgl. WO-A 95/14009; WO-A 96/36229; WO-A 97/02255]. Sie können auf dem folgenden Syntheseweg erhalten werden:

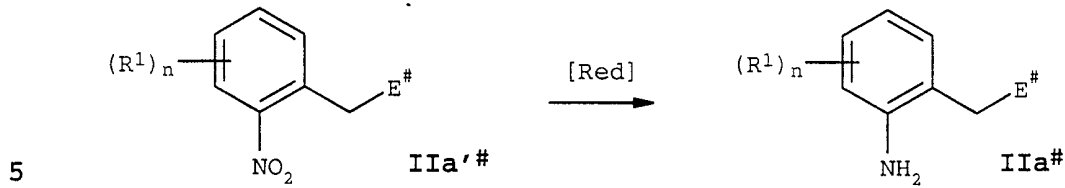


Verbindungen der Formel IIa[#], in denen R^a für Alkyl steht, erhält man auf den aus US 4,952,573 und WO-A 96/36229 bekannten Wegen aus den entsprechenden Phenylelessigsäureestern IIh[#].



Verbindungen der Formel IIB[#] sind auf folgendem Syntheseweg zu-
45 gänglich [vgl. WO-A 95/14009; WO-A 96/36229; WO-A 97/02255]:

6

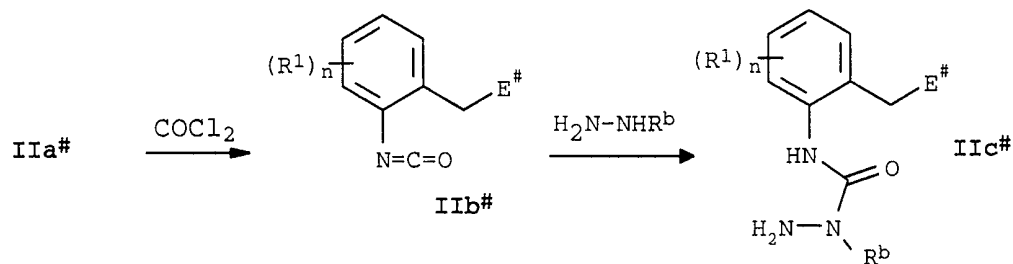


Die Reduktion der Nitrogruppe von IIa'# kann unter allgemein üblichen Bedingungen durchgeführt werden, bevorzugt durch katalytische Hydrierung, durch Reduktion mit Eisen, Zinn oder Zink in Gegenwart einer Säure, durch Reduktion mit Alkalimetallen in Gegenwart einer Base oder durch enzymkatalysierte Reduktion [vgl. Houben-Weyl, Bd. IV/1c, 4. Aufl., S. 506ff., Thieme Verlag Stuttgart und New York (1980); ebd. Bd. IV/1d, 4. Aufl., S. 473ff. (1981); Heterocycles, Bd. 31, S. 2201 (1990)]

15

Nitrobenzolderivate der Formel IIa'# sind z. T. aus der Literatur bekannt [vgl. WO-A 93/15046; WO-A 95/14009] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

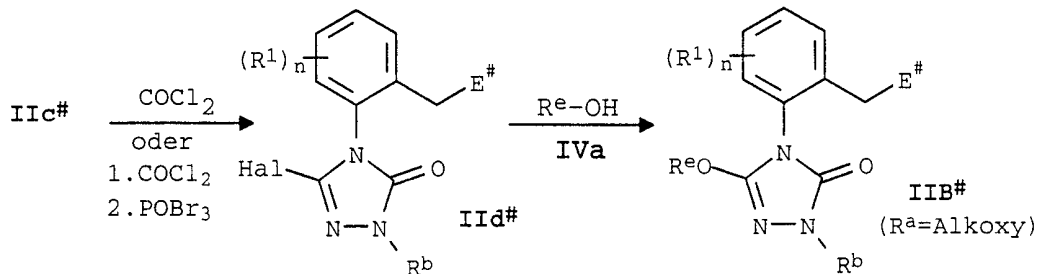
20



25

Die Umsetzung von IIa# mit Phosgen oder einem Phosgenäquivalent, wie beispielsweise Di- oder Triphosgen oder Chlorameisensäurephenylester, erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -10°C bis 250°C, vorzugsweise 10°C bis 110°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base oder eines Katalysators [vgl. Chem. Ber., Bd. 72, S. 457 (1972); Chem. Soc. Rev., Bd. 3, S. 209 (1974); Angew. Chem., Bd. 107, S. 2746 (1995)].

35

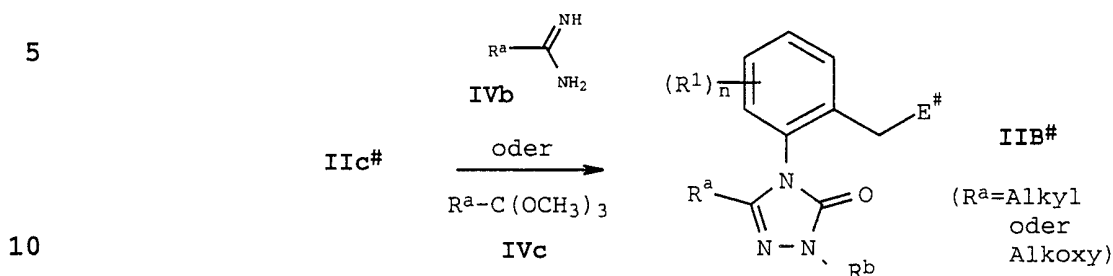


40

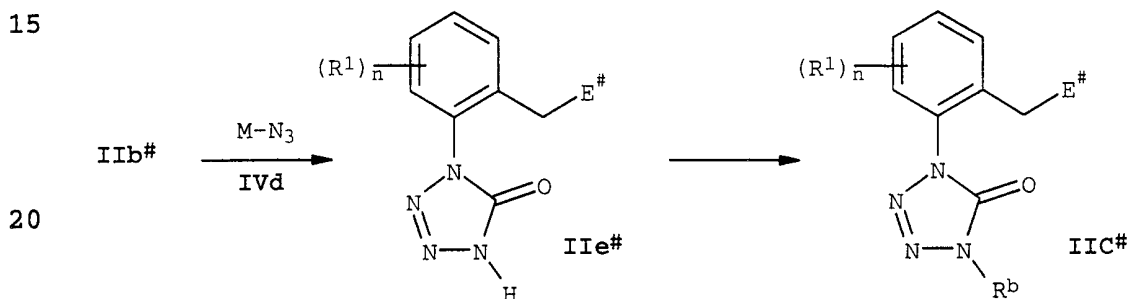
In der Formel IIId# steht "Hal" für ein Halogenatom, wie Chlor oder Brom.

45 Die für die Herstellung der Verbindungen IB, in denen R^a für Alkyl oder Alkoxy steht, benötigten Benzylverbindungen IIB# sind ebenfalls aus der Literatur bekannt [vgl. WO-A 96/36229] oder sind

analog der Literatur [vgl. J. Org. Chem., Bd. 43 (1978) S. 936] zugänglich. Sie können durch Umsetzung der Carbamate der Formel IIC# mit Amidinen IVb oder Orthoestern IVc erhalten werden:



Verbindungen der Formel IIC# können auf folgendem Syntheseweg erhalten werden [vgl. WO-A 95/14009; WO-A 96/36229; WO-A 97/02255]:



Die Umsetzung der Isocyanate IIB# mit mit Aziden IVd erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -10°C bis 200°C, vorzugsweise 20°C bis 140°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel ggf. in Gegenwart einer Base oder einer Säure [vgl. J. Org. Chem., Bd. 45, S. 5130 (1980); J. Am. Chem. Soc., Bd. 81, S. 3076 (1959); Tetrahedron, Bd. 31, S. 765 (1975); J. Org. Chem., Bd. 38, S. 675 (1973)].

30 In der Formel IVd steht M für ein Kation aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Trialkylsilyl oder Alkyl. Bevorzugt wird Trimethylsilylazid verwendet.

35 Die Alkylierung der Tetrazolinone IIE# zu IIC# erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -20°C bis 180°C, vorzugsweise 20°C bis 120°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. Synth. Commun., Bd. 18, S. 2011 (1988); J. Chem. Soc. Chem. Commun., S. 735 (1987)].

40 Als Alkylierungsagens kommen beispielsweise Alkylhalogenide, Alkylsulfonate, Alkyl-p-toluolsulfonate, Alkyl-trifluormethansulfonate, Alkohole, Dialkylether oder Alkyl-p-bromphenylsulfonate, insbesondere Methyljodid oder Dimethylsulfat in Betracht.

45

Sofern E# in den Formeln IIA#, IIB#, bzw. IIC# für die Pyrazol-, bzw. Triazolgruppierung steht, entsprechen die Verbindungen IIA#, IIB#, bzw. IIC# den Verbindungen IA, IB, bzw. IC.

5 Diese Synthesen sind nicht nur zur Herstellung der Benzylverbindungen II#, sondern prinzipiell auf jeder Synthesestufe der Pyrazol-, bzw. Triazolgruppierung für den Aufbau der Gruppen A, B bzw. C geeignet. Besonders bevorzugt erfolgt der Aufbau der Gruppierung X auf der Stufe der Verbindungen IIA'# oder IIB#, in denen
10 E# für Wasserstoff oder die Pyrazol- bzw. Triazolgruppierung steht.

3-Hydroxypyrazole IIIa sind ebenfalls aus der Literatur bekannt oder können nach den dort beschriebenen Methoden hergestellt werden [J. Heterocycl. Chem. 30, 49 (1993), Chem. Ber. 107, 1318
15 (1974), Chem. Pharm. Bull. 19, 1389 (1971), Tetrahedron Lett. 11, 875 (1970) Chem. Heterocycl. Comp. 5, 527 (1969), Chem. Ber. 102, 3260 (1969), Chem. Ber. 109, 261 (1976), J. Org. Chem. 31, 1538 (1966), Tetrahedron 43, 607 (1987)].

20

Besonders vorteilhaft erhält man die 3-Hydroxypyrazole IIIa nach den in WO-A 97/03969 und DE Anm. Nr. 19 652 516.0 beschriebenen Verfahren.

25 3-Hydroxytriazole IIIb sind ebenfalls aus der Literatur bekannt oder können nach den dort beschriebenen Methoden hergestellt werden [Chem. Ber. 56, 1794 (1923); DE-A 21 50 169; DE-A 22 00 436; US-A 4,433,148; J. Med. Chem. 33, 2772 (1990); Synthesis 1987, 986; DE-A 22 60 015; DE-A 24 17 970].

30

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig
35 erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

40

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

45

Die Verbindungen I können saure oder basische Zentren enthalten und dementsprechend Säureadditionsprodukte oder Basenadditionsprodukte oder Salze bilden.

- 5 Säuren für Säureadditionsprodukte sind u.a. Mineralsäuren (z.B. Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoff- und Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäure, Schwefelsäure, Salpetersäure), organische Säuren (z.B. Ameisensäure, Essigsäure, Oxalsäure, Malonsäure, Milchsäure, Äpfelsäure, Bernsteinsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salizylsäure, p-Toluolsulfonsäure, Dodecylbenzolsulfonsäure) oder andere protonenacide Verbindungen (z.B. Saccharin).
10 Basen für Basenadditionsprodukte sind u.a. Oxide, Hydroxide, Carbonate oder Hydrogencarbonate von Alkalimetallen oder Erdalkalimetallen (z.B. Kalium- oder Natriumhydroxyd oder -carbonat)
15 oder Ammoniumverbindungen (z.B. Ammoniumhydroxyd).

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden z.T. Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

20

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

- Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4 oder 6 Kohlenstoffatomen, z.B. Methyl,
25 Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methyl-propyl und 1,1-Dimethylethyl;

- Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei diese in
30 Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl,
35 ethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

- Alkylcarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen, insbesondere mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;
40

- Alkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;
45

Alkoxy-carbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

5 Alkylthio: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen
10 mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

Aryl: ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem enthaltend 6 bis 14 Kohlenstoffringglieder, z.B. Phenyl, Naphthyl und
15 Anthracenyl;

Hetaryl: 5- oder 6-gliedrige Heteroaromaten, z.B.

- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 25 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 30 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;

- benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein Stickstoffatom und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können;
40

über Stickstoff gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome, oder über Stickstoff gebundenes benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome bzw. ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder oder ein Stick-
45

stoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können, wobei diese Ringe über eines der Stickstoffringglieder an das Gerüst gebunden sind;

- 5 - 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

Der Zusatz "ggf. subst" in Bezug auf Alkyl-, Alkenyl- und Alkinyllgruppen soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können (d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt (vorzugsweise Fluor, Chlor und Brom, insbesondere Fluor und Chlor) ersetzt sein können und/oder einen bis drei, insbesondere einen, der folgenden Reste tragen können:

C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyloxy, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkenyloxy,

oder ein ggf. subst. ein- oder zweikerniges aromatisches Ringsystem, welches neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann (wie vorstehend genannt), welches direkt oder über ein Sauerstoffatom (-O-), ein Schwefelatom (-S-) oder eine Aminogruppe (-NR^a-) an den Substituenten gebunden sein kann, d.h. Arylreste wie Phenyl und Naphthyl, vorzugsweise Phenyl oder 1- oder 2-Naphthyl, und Hetarylreste, beispielsweise 5-Ring Heteroaromaten enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 1-Pyrrolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 1-Pyrazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 1-Imidazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,5-Triazol-3-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 5-Tetrazolyl, 1,2,3,4-Thiatriazol-5-yl und 1,2,3,4-Oxatriazol-5-yl, insbeson-

dere 3-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 4-Oxazolyl, 4-Thiazolyl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl und 1,3,4-Thiadiazol-2-yl;

Sechsring-Heteroaromaten enthaltend ein bis vier Stickstoffatome
5 als Heteroatome wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl und 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl, insbesondere 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl und 4-Pyridazinyl.
10

Der Zusatz "ggf. subst" in Bezug auf die *cyclischen (gesättigten, ungesättigten oder aromatischen) Gruppen* soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein
15 können [d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt (vorzugsweise Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere Fluor oder Chlor) ersetzt sein] und/oder einen bis vier (insbesondere einen bis drei) der folgenden Reste tragen können:

20 - Cyano, Nitro, Hydroxy, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Haloalkenyl, Alkenyloxy, Haloalkenyloxy, Alkinyl, Haloalkinyl, Alkinyloxy, Haloalkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylcarbonylamino, Alkoxycarbonylamino, Alkylcarbonyl-N-alkylamino und Alkylcarbonyl-N-alkylamino, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8, vorzugsweise 2 bis 6, insbesondere 2 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei (insbesondere einen) der folgenden Reste:

- unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino,
35 Cycloalkyl-N-alkylamino, Heterocyclyl, Heterocyclioxy, Heterocyclylthio, Heterocyclylamino oder Heterocyclyl-N-alkylamino, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 12 Ringglieder, vorzugsweise 2 bis 8 Ringglieder, insbesondere 3 bis 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6
40 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;

- unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylamino, Aryl-N-alkylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylamino, Arylalkyl-N-alkylamino,
45 Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, Hetarylamino, Hetaryl-N-alkylamino, Hetarylalkoxy, Hetarylalkylthio, Hetarylalkylamino und Hetarylalkyl-N-alkylamino, wobei die Arylreste vorzugsweise

6 bis 10 Ringglieder, insbesondere 6 Ringglieder (Phenyl) enthalten, die Hetarylreste insbesondere 5 oder 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten

und/oder einen oder zwei (insbesondere einen) der folgenden Reste tragen kann:

- Formyl,
- CRⁱⁱⁱ=NOR^{iv} [wobei Rⁱⁱⁱ Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl und Aryl und R^{iv} Alkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkinyl und Arylalkyl bedeutet (wobei die genannten Alkylgruppen vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome, enthalten, die genannten Cycloalkylgruppen, Alkenylgruppen und Alkinylgruppen vorzugsweise 3 bis 8, insbesondere 3 bis 6, Kohlenstoffatome enthalten) und Aryl insbesondere Phenyl bedeutet, welches unsubstituiert ist oder durch übliche Gruppen substituiert sein kann] oder
- NR^v-CO-D-R^{vi} [wobei R^v für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl steht, R^{vi} für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl und Hetaryl-C₁-C₆-alkyl steht und D eine direkte Bindung, Sauerstoff oder Stickstoff bedeutet, wobei der Stickstoff eine der bei R^{vi} genannten Gruppen tragen kann],

und/oder bei denen zwei benachbarte C-Atome der cyclischen Systeme eine C₃-C₅-Alkylen-, C₃-C₅-Alkenylen-, Oxy-C₂-C₄-alkylen-, Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy, Oxy-C₂-C₄-alkenylen-, Oxy-C₂-C₄-alkenylenoxy- oder Butadiendiylgruppe tragen können, wobei diese Brücken ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen bis drei, insbesondere einen oder zwei der folgenden Reste tragen können:

- C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy und C₁-C₄-Alkylthio.

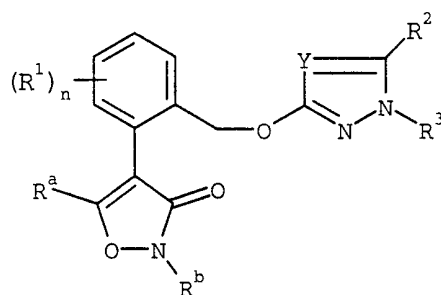
Im Hinblick auf ihre biologische Wirkung sind Verbindungen IA bevorzugt.

40

45

14

5

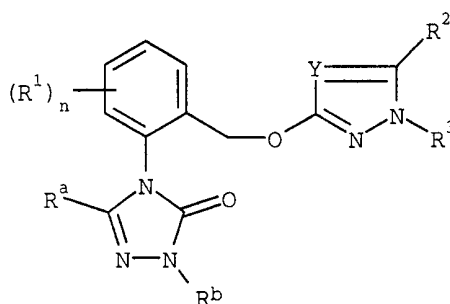


IA

10

Daneben sind auch Verbindungen der Formel IB bevorzugt.

15

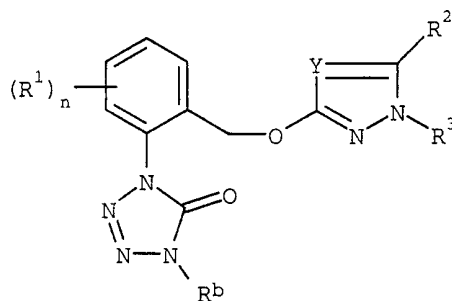


IB

20

Gleichermaßen sind Verbindungen IC bevorzugt.

25



IC

30

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^a für Methoxy
35 steht.

Daneben werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R^a für
Methyl steht.

40 Desweiteren werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R^b für
Methyl steht.

Gleichermaßen sind Verbindungen I bevorzugt, in denen n für 0
oder 1, insbesondere für 0, steht.

45

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ in 6-Stellung steht.

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für Halogen 5 oder Methyl steht.

Gleichermaßen werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R² für Wasserstoff steht.

10 Desweiteren werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R³ für ggf. subst. C₁-C₆-Alkyl steht.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R³ für Phenyl oder Benzyl steht, wobei der Phenylrest partiell oder
15 vollständig halogeniert sein kann und/oder

- einen bis drei der folgenden Reste: Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Phenyl, Phenoxy und Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, wobei die Phenylringe ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei der folgenden Reste tragen können: Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, und/oder
- 20
- 25
- eine Gruppe CR'="NOR", in der R' Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeutet und R" für C₁-C₆-Alkyl steht, und/oder
- 30
- zwei benachbarte C-Atome des Phenylrings über eine Oxy-C₁-C₃-alkoxy-Brücke oder eine Oxy-C₁-C₃-halogenalkoxy-Brücke verbunden sein können,

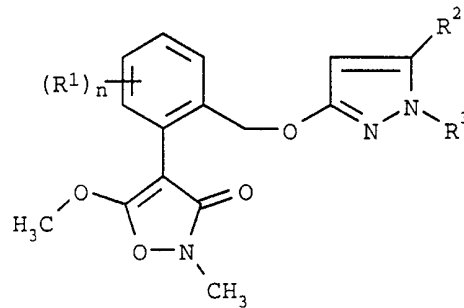
35 tragen kann.

Außerdem werden Verbindungen I insbesondere bevorzugt, in denen R³ für Pyridyl steht, wobei der Pyridylring partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl.
40

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^b für Wasserstoff steht.
45

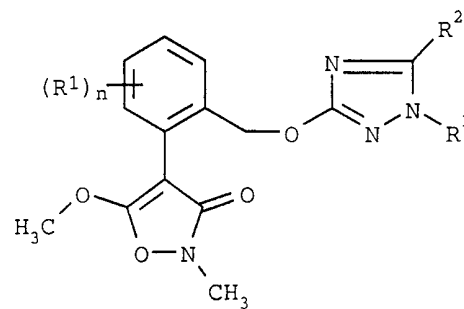
Außerdem werden Verbindungen IA.1, IA.2, IA.3 und IA.4 besonders bevorzugt, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff, 6-Chlor oder 6-Methyl, R^2 für Wasserstoff oder Methyl und R^3 für ggf. durch Halogen oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl substituiertes Cyclohexyl, Benzyl, Phenyl, Pyridyl oder Pyrazinyl steht.

10



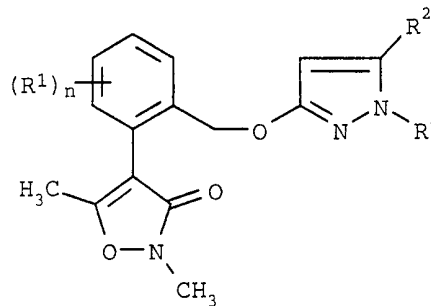
IA.1

15



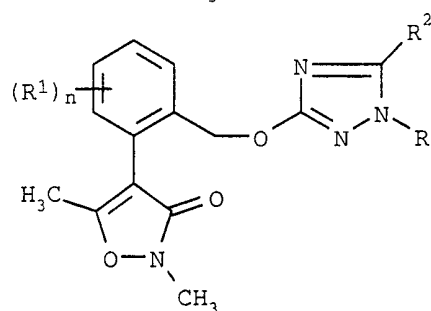
IA.2

20



IA.3

30



IA.4

35

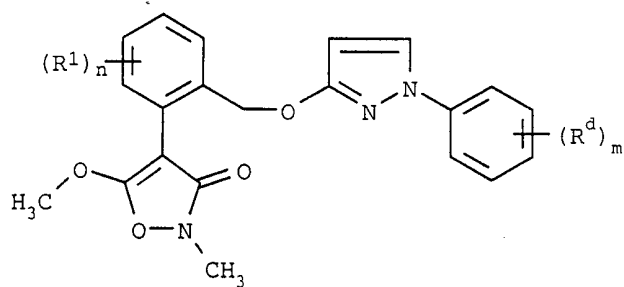
Daneben werden Verbindungen IA.5, IA.6, IA.7, IA.8, IA.9, IA.10, IA.11 und IA.12 besonders bevorzugt, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff, 6-Chlor oder 6-Methyl, R^d für Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_9 -Alkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl, Cyclohexyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Halogenalkoxy, Phenyl- C_1 - C_3 -alkoxy oder Phenyl, wobei die Phenylringe ggf. durch Halogen, Methyl oder Methoxy substituiert sein können, Pyridyl, C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl, Methoxymethyl oder eine Gruppe $C(CH_3)=N-C_1-C_4$ -alkoxy steht und der Index m 1-5, insbesondere 1 oder 2 bedeutet.

40

45

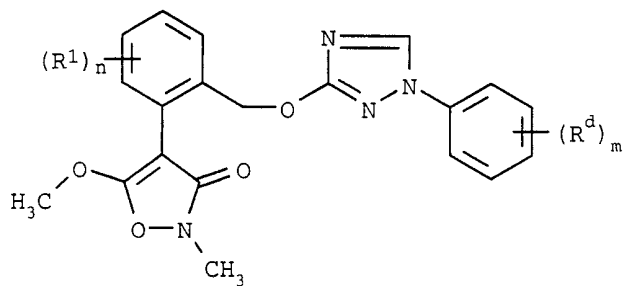
17

5



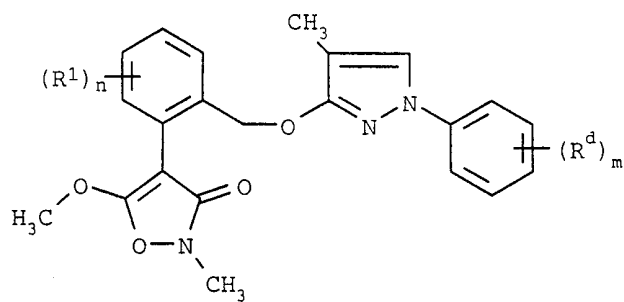
IA.5

10



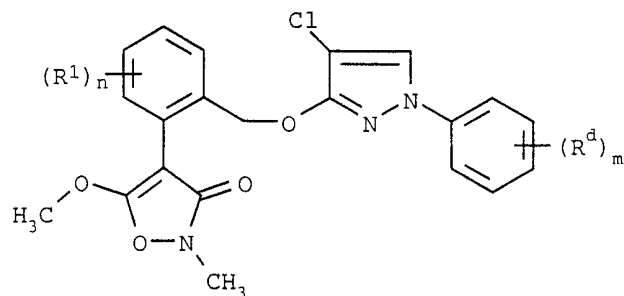
IA.6

15



IA.7

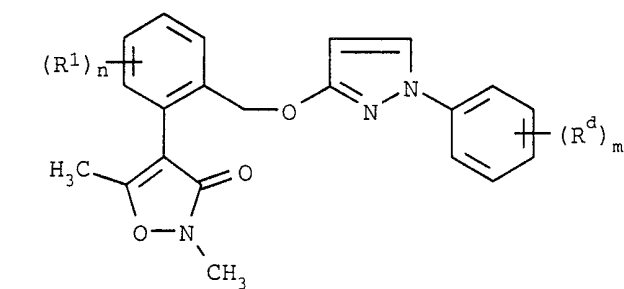
20



IA.8

25

30



IA.9

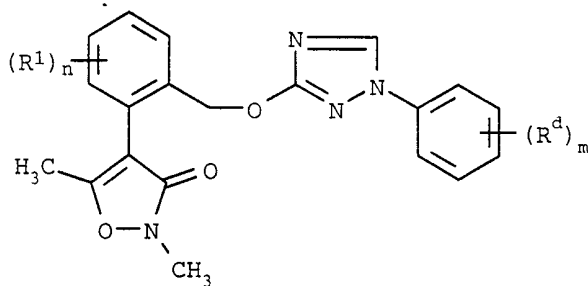
35

40

45

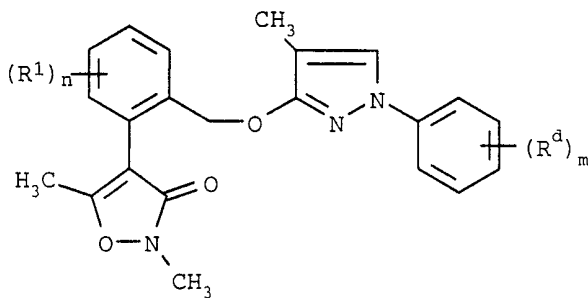
18

5



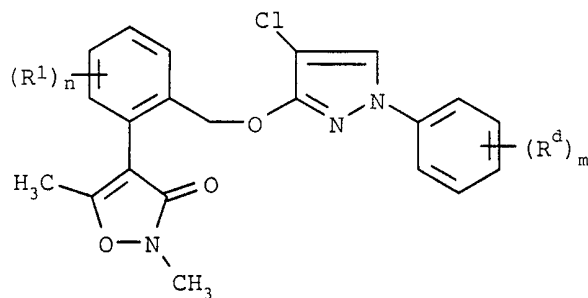
IA.10

10



IA.11

15

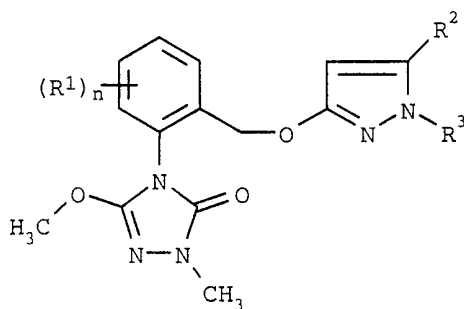


IA.12

25

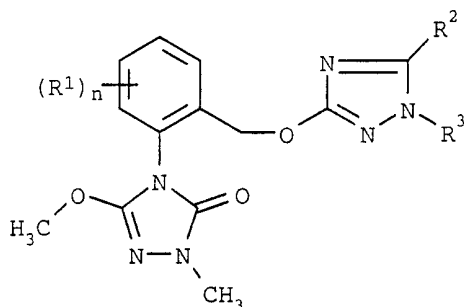
Insbesondere werden auch Verbindungen IB.1, IB.2, IB.3 und IB.4 besonders bevorzugt, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff, 6-Chlor oder 6-Methyl, R^2 für Wasserstoff oder Methyl und R^3 für ggf. durch Halogen oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl substituiertes Cyclohexyl, Benzyl, Phenyl, Pyridyl oder Pyrazinyl steht.

35



IB.1

40

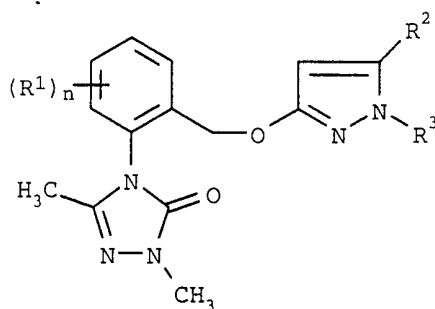


IB.2

45

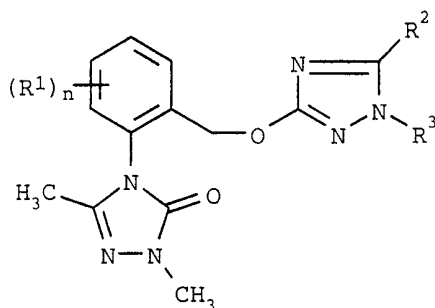
19

5



IB.3

10

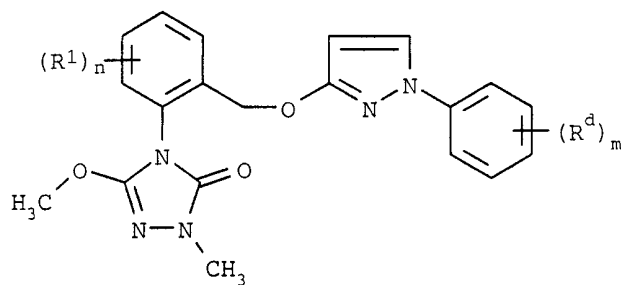


IB.4

15

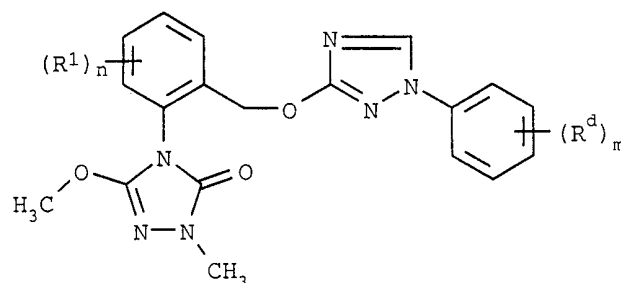
Außerdem werden Verbindungen IB.5, IB.6, IB.7, IB.8, IB.9, IB.10, IB.11 und IB.12 besonders bevorzugt, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff, 6-Chlor oder 6-Methyl, R^d für Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_9 -Alkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl, Cyclohexyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Halogenalkoxy, Phenyl- C_1 - C_3 -alkoxy oder Phenyl, wobei die Phenylringe ggf. durch Halogen, Methyl oder Methoxy substituiert sein können, Pyridyl, C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl, Methoxymethyl oder eine Gruppe $C(CH_3)=N-C_1-C_4$ -alkoxy steht und der Index m 1-5, insbesondere 1 oder 2 bedeutet.

30



IB.5

35

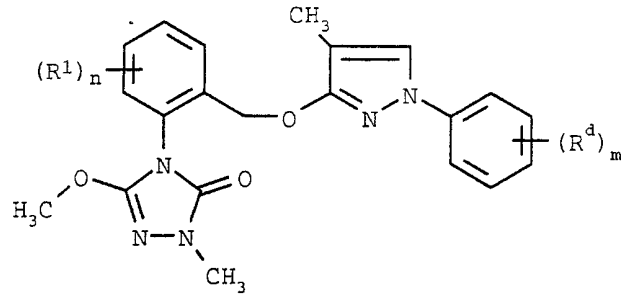


IB.6

40

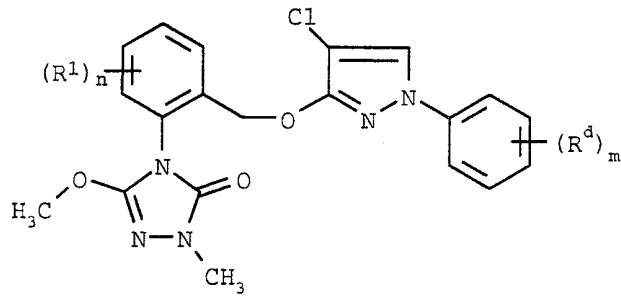
45

5



IB.7

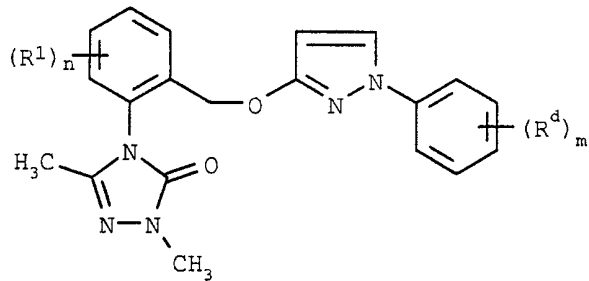
10



IB.8

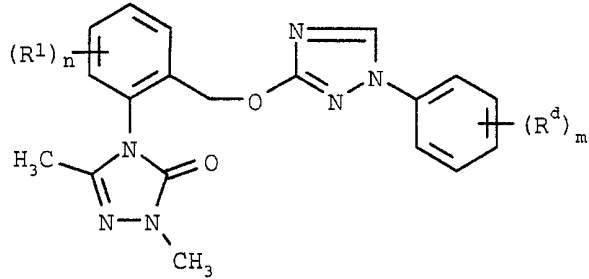
15

20



IB.9

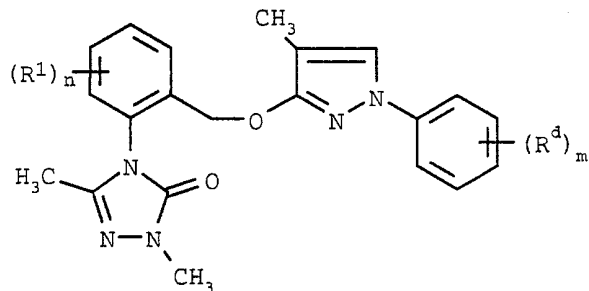
25



IB.10

30

35

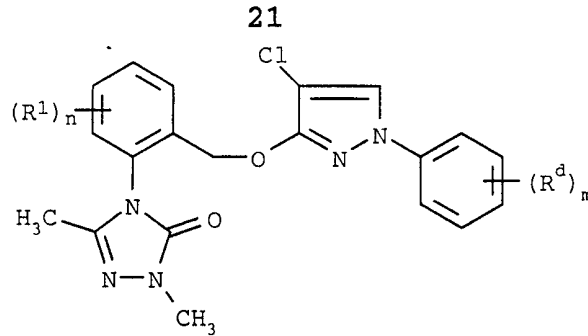


IB.11

40

45

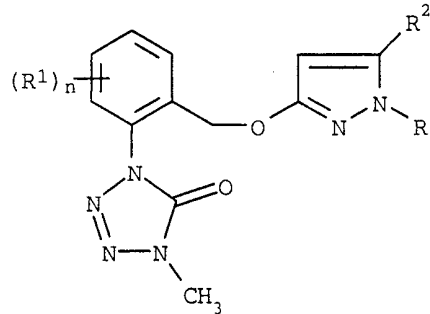
5



IB.12

10 Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen IC.1 und IC.2, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff, 6-Chlor oder 6-Methyl, R^2 für Wasserstoff oder Methyl und R^3 für ggf. durch Halogen oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl substituiertes Cyclohexyl, Benzyl, Phenyl, Pyridyl oder Pyrazinyl steht.

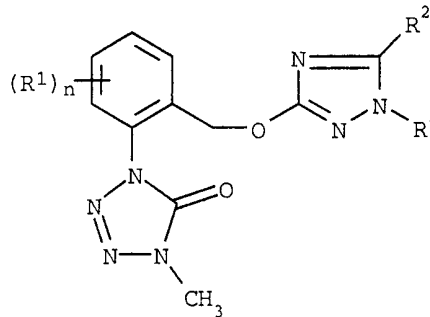
15



IC.1

20

25



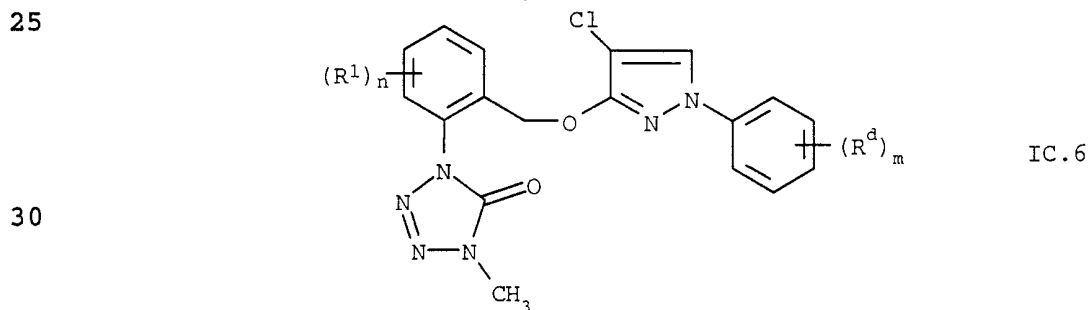
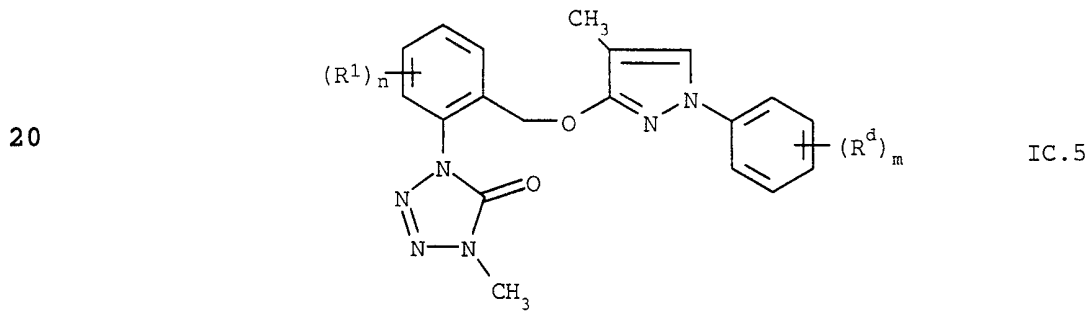
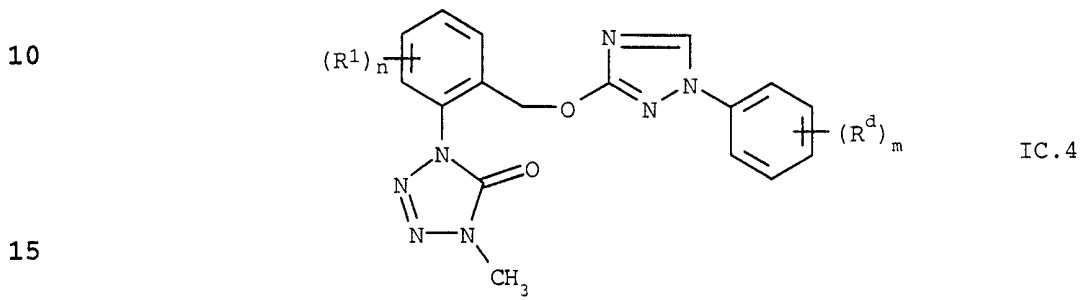
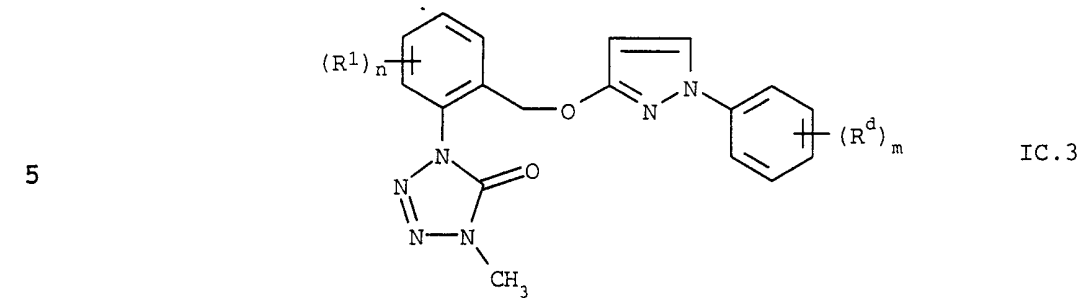
IC.2

30

Daneben werden Verbindungen IC.3, IC.4, IC.5 und IC.6 besonders
 35 bevorzugt, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff, 6-Chlor oder 6-Methyl, R^d für Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_9 -Alkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl, Cyclohexyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_2 -Halogenalkoxy, Phenyl- C_1 - C_3 -alkoxy oder Phenyl, wobei die Phenylringe ggf. durch Halogen, Methyl oder Methoxy substituiert sein können, Pyridyl, C_1 - C_4 -Alkoxycarbo-
 40 nyl, Methoxymethyl oder eine Gruppe $C(CH_3)=N-C_1-C_4$ -alkoxy steht und der Index m 1-5, insbesondere 1 oder 2 bedeutet.

45

22



25

30

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte
35 in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Gruppen, bzw.
Reste A, B, C, Y, Ra, Rb, (R¹)_n, R² und R³ der Formel I.

40

45

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in 5 der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

Verbindungen der Formel IA.1, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine 10 Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 2

Verbindungen der Formel IA.2, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine 15 Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

Verbindungen der Formel IA.3, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 Tabelle 4

Verbindungen der Formel IA.4, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 5

25 Verbindungen der Formel IA.5, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 6

Verbindungen der Formel IA.5, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und 30 $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 7

Verbindungen der Formel IA.5, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht 35

Tabelle 8

Verbindungen der Formel IA.6, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

40 Tabelle 9

Verbindungen der Formel IA.6, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 10

45 Verbindungen der Formel IA.6, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 11

Verbindungen der Formel IA.7, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

5 Tabelle 12

Verbindungen der Formel IA.8, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 13

10 Verbindungen der Formel IA.9, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 14

Verbindungen der Formel IA.9, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und
15 $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 15

Verbindungen der Formel IA.9, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

20

Tabelle 16

Verbindungen der Formel IA.10, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

25

Tabelle 17

Verbindungen der Formel IA.10, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

30 Tabelle 18

Verbindungen der Formel IA.10, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 19

35 Verbindungen der Formel IA.11, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 20

40 Verbindungen der Formel IA.12, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

45

Tabelle 21

Verbindungen der Formel IB.1, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 22

Verbindungen der Formel IB.2, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 23

10 Verbindungen der Formel IB.3, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 24

Verbindungen der Formel IB.4, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine
15 Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 25

Verbindungen der Formel IB.5, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht
und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht
20

Tabelle 26

Verbindungen der Formel IB.5, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und
 $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

25 Tabelle 27

Verbindungen der Formel IB.5, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht
und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 28

30 Verbindungen der Formel IB.6, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht
und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 29

Verbindungen der Formel IB.6, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und
35 $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 30

Verbindungen der Formel IB.6, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht
und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht
40

Tabelle 31

Verbindungen der Formel IB.7, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht
und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

45 Tabelle 32

Verbindungen der Formel IB.8, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht
und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 33

Verbindungen der Formel IB.9, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

5 Tabelle 34

Verbindungen der Formel IB.9, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 35

10 Verbindungen der Formel IB.9, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 36

15 Verbindungen der Formel IB.10, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 37

20 Verbindungen der Formel IB.10, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 38

25 Verbindungen der Formel IB.10, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 39

30 Verbindungen der Formel IB.11, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 40

35 Verbindungen der Formel IB.12, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 41

Verbindungen der Formel IC.1, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

40 Tabelle 42

Verbindungen der Formel IC.2, in denen $(R^1)_n$, R^2 und R^3 für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 43

45 Verbindungen der Formel IC.3, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 44

Verbindungen der Formel IC.3, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

5 Tabelle 45

Verbindungen der Formel IC.3, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 46

10 Verbindungen der Formel IC.4, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 47

15 Verbindungen der Formel IC.4, in denen $(R^1)_n$ für 6-Chlor steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 48

20 Verbindungen der Formel IC.4, in denen $(R^1)_n$ für 6-Methyl steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 49

Verbindungen der Formel IC.5, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

25 Tabelle 50

Verbindungen der Formel IC.6, in denen $(R^1)_n$ für Wasserstoff steht und $(R^d)_m$ für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle A

30

Nr.	$(R^1)_n$	R^2	R^3
A-1	H	H	Cyclohexyl
A-2	H	H	Benzyl
35 A-3	H	H	Phenyl
A-4	H	H	2-Pyridyl
A-5	H	H	5-Cl-pyridyl-2
A-6	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2
40 A-7	H	H	2-Pyrazinyl
A-8	H	CH ₃	Cyclohexyl
A-9	H	CH ₃	Benzyl
A-10	H	CH ₃	Phenyl
45 A-11	H	CH ₃	2-Pyridyl
A-12	H	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2
A-13	H	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2

	Nr.	(R ¹) _n	R ²	R ³
	A-14	H	CH ₃	2-Pyrazinyl
	A-15	6-Cl	H	Cyclohexyl
5	A-16	6-Cl	H	Benzyl
	A-17	6-Cl	H	Phenyl
	A-18	6-Cl	H	2-Pyridyl
	A-19	6-Cl	H	5-Cl-pyridyl-2
10	A-20	6-Cl	H	5-CF ₃ -pyridyl-2
	A-21	6-Cl	H	2-Pyrazinyl
	A-22	6-Cl	CH ₃	Cyclohexyl
	A-23	6-Cl	CH ₃	Benzyl
15	A-24	6-Cl	CH ₃	Phenyl
	A-25	6-Cl	CH ₃	2-Pyridyl
	A-26	6-Cl	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2
	A-27	6-Cl	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2
20	A-28	6-Cl	CH ₃	2-Pyrazinyl
	A-29	6-CH ₃	H	Cyclohexyl
	A-30	6-CH ₃	H	Benzyl
	A-31	6-CH ₃	H	Phenyl
25	A-32	6-CH ₃	H	2-Pyridyl
	A-33	6-CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2
	A-34	6-CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2
	A-35	6-CH ₃	H	2-Pyrazinyl
30	A-36	6-CH ₃	CH ₃	Cyclohexyl
	A-37	6-CH ₃	CH ₃	Benzyl
	A-38	6-CH ₃	CH ₃	Phenyl
	A-39	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl
35	A-40	6-CH ₃	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2
	A-41	6-CH ₃	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2
	A-42	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyrazinyl

Tabelle B

	Nr.	(R ^d) _m
	B-1	H
	B-2	2-F
	B-3	3-F
45	B-4	4-F
	B-5	2,4-F ₂

	Nr.	(R ^d) _m
	B-6	2,4,6-F ₃
	B-7	2,3,4,5,6-F ₅
5	B-8	2,3-F ₂
	B-9	2-Cl
	B-10	3-Cl
	B-11	4-Cl
10	B-12	2,3-Cl ₂
	B-13	2,4-Cl ₂
	B-14	2,5-Cl ₂
	B-15	2,6-Cl ₂
15	B-16	3,4-Cl ₂
	B-17	3,5-Cl ₂
	B-18	2,3,4-Cl ₃
	B-19	2,3,5-Cl ₃
20	B-20	2,3,6-Cl ₃
	B-21	2,4,5-Cl ₃
	B-22	2,4,6-Cl ₃
	B-23	3,4,5-Cl ₃
25	B-24	2,3,4,6-Cl ₄
	B-25	2,3,5,6-Cl ₄
	B-26	2,3,4,5,6-Cl ₅
	B-27	2-Br
30	B-28	3-Br
	B-29	4-Br
	B-30	2,4-Br ₂
	B-31	2,5-Br ₂
35	B-32	2,6-Br ₂
	B-33	2,4,6-Br ₃
	B-34	2,3,4,5,6-Br ₅
	B-35	2-J
40	B-36	3-J
	B-37	4-J
	B-38	2,4-J ₂
	B-39	2-Cl, 3-F
45	B-40	2-Cl, 4-F
	B-41	2-Cl, 5-F
	B-42	2-Cl, 6-F

	Nr.	(R ^d) _m
	B-43	2-Cl, 3-Br
	B-44	2-Cl, 4-Br
5	B-45	2-Cl, 5-Br
	B-46	2-Cl, 6-Br
	B-47	2-Br, 3-Cl
	B-48	2-Br, 4-Cl
10	B-49	2-Br, 5-Cl
	B-50	2-Br, 3-F
	B-51	2-Br, 4-F
	B-52	2-Br, 5-F
15	B-53	2-Br, 6-F
	B-54	2-F, 3-Cl
	B-55	2-F, 4-Cl
	B-56	2-F, 5-Cl
20	B-57	3-Cl, 4-F
	B-58	3-Cl, 5-F
	B-59	3-Cl, 4-Br
	B-60	3-Cl, 5-Br
25	B-61	3-F, 4-Cl
	B-62	3-F, 4-Br
	B-63	3-Br, 4-Cl
	B-64	3-Br, 4-F
30	B-65	2,6-Cl ₂ , 4-Br
	B-66	2-CH ₃
	B-67	3-CH ₃
	B-68	4-CH ₃
35	B-69	2,3-(CH ₃) ₂
	B-70	2,4-(CH ₃) ₂
	B-71	2,5-(CH ₃) ₂
	B-72	2,6-(CH ₃) ₂
40	B-73	3,4-(CH ₃) ₂
	B-74	3,5-(CH ₃) ₂
	B-75	2,3,5-(CH ₃) ₃
	B-76	2,3,4-(CH ₃) ₃
45	B-77	2,3,6-(CH ₃) ₃
	B-78	2,4,5-(CH ₃) ₃
	B-79	2,4,6-(CH ₃) ₃

Nr.	(R ^d) _m
B-80	3,4,5-(CH ₃) ₃
B-81	2,3,4,6-(CH ₃) ₄
5 B-82	2,3,5,6-(CH ₃) ₄
B-83	2,3,4,5,6-(CH ₃) ₅
B-84	2-C ₂ H ₅
B-85	3-C ₂ H ₅
10 B-86	4-C ₂ H ₅
B-87	2,4-(C ₂ H ₅) ₂
B-88	2,6-(C ₂ H ₅) ₂
B-89	3,5-(C ₂ H ₅) ₂
15 B-90	2,4,6-(C ₂ H ₅) ₃
B-91	2-n-C ₃ H ₇
B-92	3-n-C ₃ H ₇
B-93	4-n-C ₃ H ₇
20 B-94	2-i-C ₃ H ₇
B-95	3-i-C ₃ H ₇
B-96	4-i-C ₃ H ₇
B-97	2,4-(i-C ₃ H ₇) ₂
25 B-98	2,6-(i-C ₃ H ₇) ₂
B-99	3,5-(i-C ₃ H ₇) ₂
B-100	2-s-C ₄ H ₉
B-101	3-s-C ₄ H ₉
30 B-102	4-s-C ₄ H ₉
B-103	2-t-C ₄ H ₉
B-104	3-t-C ₄ H ₉
B-105	4-t-C ₄ H ₉
35 B-106	4-n-C ₉ H ₁₉
B-107	2-CH ₃ , 4-t-C ₄ H ₉
B-108	2-CH ₃ , 6-t-C ₄ H ₉
B-109	2-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇
40 B-110	2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇
B-111	3-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇
B-112	2-cyclo-C ₆ H ₁₁
B-113	3-cyclo-C ₆ H ₁₁
B-114	4-cyclo-C ₆ H ₁₁
45 B-115	2-Cl, 4-C ₆ H ₅
B-116	2-Br, 4-C ₆ H ₅

	Nr.	(R ^d) _m
	B-117	2-OCH ₃
	B-118	3-OCH ₃
5	B-119	4-OCH ₃
	B-120	2-OC ₂ H ₅
	B-121	3-O-C ₂ H ₅
	B-122	4-O-C ₂ H ₅
10	B-123	2-O-n-C ₃ H ₇
	B-124	3-O-n-C ₃ H ₇
	B-125	4-O-n-C ₃ H ₇
	B-126	2-O-i-C ₃ H ₇
15	B-127	3-O-i-C ₃ H ₇
	B-128	4-O-i-C ₃ H ₇
	B-129	2-O-n-C ₆ H ₁₃
	B-130	3-O-n-C ₆ H ₁₃
20	B-131	4-O-n-C ₆ H ₁₃
	B-132	2-O-CH ₂ C ₆ H ₅
	B-133	3-O-CH ₂ C ₆ H ₅
	B-134	4-O-CH ₂ C ₆ H ₅
25	B-135	2-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅
	B-136	4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅
	B-137	2,3-(OCH ₃) ₂
	B-138	2,4-(OCH ₃) ₂
30	B-139	2,5-(OCH ₃) ₂
	B-140	2,6-(OCH ₃) ₂
	B-141	3,4-(OCH ₃) ₂
	B-142	3,5-(OCH ₃) ₂
35	B-143	2-O-t-C ₄ H ₉
	B-144	3-O-t-C ₄ H ₉
	B-145	4-O-t-C ₄ H ₉
	B-146	3-(3'-Cl-C ₆ H ₄)
40	B-147	4-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄)
	B-148	2-O-C ₆ H ₅
	B-149	3-O-C ₆ H ₅
	B-150	4-O-C ₆ H ₅
45	B-151	2-O-(2'-F-C ₆ H ₄)
	B-152	3-O-(3'-Cl-C ₆ H ₄)
	B-153	4-O-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄)

Nr.	(R ^d) _m
B-154	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-F
B-155	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Cl
5 B-156	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Br
B-157	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-F
B-158	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Cl
B-159	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Br
10 B-160	2-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl, 5-CH ₃
B-161	2-Cl, 4-NO ₂
B-162	2-NO ₂ , 4-Cl
B-163	2-OCH ₃ , 5-NO ₂
15 B-164	2,4-Cl ₂ , 5-NO ₂
B-165	2,4-Cl ₂ , 6-NO ₂
B-166	2,6-Cl ₂ , 4-NO ₂
B-167	2,6-Br ₂ , 4-NO ₂
20 B-168	2,6-J ₂ , 4-NO ₂
B-169	2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl
B-170	2-CO ₂ CH ₃
B-171	3-CO ₂ CH ₃
25 B-172	4-CO ₂ CH ₃
B-173	2-CH ₂ -OCH ₃
B-174	3-CH ₂ -OCH ₃
B-175	4-CH ₂ -OCH ₃
30 B-176	2-Me-4-CH ₃ -CH(CH ₃)-CO
B-177	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃)
B-178	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOC ₂ H ₅)
B-179	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇)
35 B-180	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇)
B-181	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃)
B-182	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOC ₂ H ₅)
B-183	2,5-(CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇)
40 B-184	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇)
B-185	2-C ₆ H ₅
B-186	3-C ₆ H ₅
B-187	4-C ₆ H ₅
B-188	2-(2'-F-C ₆ H ₄)
45 B-189	2-CH ₃ , 5-Br
B-190	2-CH ₃ , 6-Br

Nr.	(R ^d) _m
	B-191 2-Cl, 3-CH ₃
	B-192 2-Cl, 4-CH ₃
5	B-193 2-Cl, 5-CH ₃
	B-194 2-F, 3-CH ₃
	B-195 2-F, 4-CH ₃
	B-196 2-F, 5-CH ₃
10	B-197 2-Br, 3-CH ₃
	B-198 2-Br, 4-CH ₃
	B-199 2-Br, 5-CH ₃
	B-200 3-CH ₃ , 4-Cl
15	B-201 3-CH ₃ , 5-Cl
	B-202 3-CH ₃ , 4-F
	B-203 3-CH ₃ , 5-F
	B-204 3-CH ₃ , 4-Br
20	B-205 3-CH ₃ , 5-Br
	B-206 3-F, 4-CH ₃
	B-207 3-Cl, 4-CH ₃
	B-208 3-Br, 4-CH ₃
25	B-209 2-Cl, 4,5-(CH ₃) ₂
	B-210 2-Br, 4,5-(CH ₃) ₂
	B-211 2-Cl, 3,5-(CH ₃) ₂
	B-212 2-Br, 3,5-(CH ₃) ₂
30	B-213 2,6-Cl ₂ , 4-CH ₃
	B-214 2,6-F ₂ , 4-CH ₃
	B-215 2,6-Br ₂ , 4-CH ₃
	B-216 2,4-Br ₂ , 6-CH ₃
35	B-217 2,4-F ₂ , 6-CH ₃
	B-218 2,4-Br ₂ , 6-CH ₃
	B-219 2,6-(CH ₃) ₂ , 4-F
	B-220 2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Cl
40	B-221 2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Br
	B-222 3,5-(CH ₃) ₂ , 4-F
	B-223 3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Cl
	B-224 3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Br
45	B-225 2-CF ₃
	B-226 3-CF ₃
	B-227 4-CF ₃

Nr.	(R ^d) _m
B-228	2-OCF ₃
B-229	3-OCF ₃
5 B-230	4-OCF ₃
B-231	3-OCH ₂ CHF ₂
B-232	2-NO ₂
B-233	3-NO ₂
10 B-234	4-NO ₂
B-235	2-CN
B-236	3-CN
B-237	4-CN
15 B-238	2-CH ₃ , 3-Cl
B-239	2-CH ₃ , 4-Cl
B-240	2-CH ₃ , 5-Cl
B-241	2-CH ₃ , 6-Cl
20 B-242	2-CH ₃ , 3-F
B-243	2-CH ₃ , 4-F
B-244	2-CH ₃ , 5-F
B-245	2-CH ₃ , 6-F
25 B-246	2-CH ₃ , 3-Br
B-247	2-CH ₃ , 4-Br
B-248	2-Pyridyl-2'
B-249	3-Pyridyl-3'
30 B-250	4-Pyridyl-4'

35

40

45

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Phycomyceten* und *Basidiomyceten*,
5 aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen,
10 Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

15 Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- 20 • *Cercospora arachidicola* an Erdnüssen,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Erysiphe graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- 25 • *Helminthosporium*-Arten an Getreide,
- *Mycosphaerella*-Arten an Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- 30 • *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 35 • *Septoria nodorum* an Weizen,
- *Ucinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

40 Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

45 Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirk-

stoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

- 5 Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

- 15 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise
20 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen der Formel I sind außerdem geeignet, tierische Schädlinge aus der Klasse der Insekten, Spinnentiere und Nematoden wirksam zu bekämpfen. Sie können im Pflanzenschutz sowie auf dem Hygiene-, Vorratsschutz- und Veterinärsektor zur Bekämpfung tierischer Schädlinge eingesetzt werden. Insbesondere eignen sie sich zur Bekämpfung der folgenden tierischen Schädlinge:

- Insekten aus der Ordnung der Schmetterlinge (Lepidoptera) beispielsweise *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseu-*

- doplusia includens, Rhyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sitotroga cerealella, Sparganothis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Thaumato-
 5 poea pityocampa, Tortrix viridana, Trichoplusia ni und Zeira-
 phera canadensis,
- Käfer (Coleoptera), z.B. Agrilus sinuatus, Agriotes lineatus, Agriotes obscurus, Amphimallus solstitialis, Anisandrus dispar, Anthonomus grandis, Anthonomus pomorum, Atomaria linearis, Blastophagus piniperda, Blitophaga undata, Bruchus rufimanus, Bru-
 10 chus pisorum, Bruchus lentis, Byctiscus betulae, Cassida nebu-
 losa, Cerotoma trifurcata, Ceuthorrhynchus assimilis, Ceuthorr-
 hynchus napi, Chaetocnema tibialis, Conoderus vespertinus, Crioceris asparagi, Diabrotica longicornis, Diabrotica 12-punc-
 tata, Diabrotica virgifera, Epilachna varivestis, Epitrix hir-
 15 tipennis, Eutinobothrus brasiliensis, Hylobius abietis, Hypera
 brunneipennis, Hypera postica, Ips typographus, Lema bilineata,
 Lema melanopus, Leptinotarsa decemlineata, Limonius californi-
 cus, Lissorhoptrus oryzophilus, Melanotus communis, Meligethes
 aeneus, Melolontha hippocastani, Melolontha melolontha, Oulema
 20 oryzae, Ortiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Phaedon
 cochleariae, Phyllotreta chrysocephala, Phyllophaga sp., Phyl-
 loptertha horticola, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata,
 Popillia japonica, Sitona lineatus und Sitophilus granaria,
 - Zweiflügler (Diptera), z.B. Aedes aegypti, Aedes vexans, Anas-
 25 trepha ludens, Anopheles maculipennis, Ceratitis capitata,
 Chrysomya bezziana, Chrysomya hominivorax, Chrysomya macella-
 ria, Contarinia sorghicola, Cordylobia anthropophaga, Culex pi-
 piens, Dacus cucurbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Fan-
 nia canicularis, Gasterophilus intestinalis, Glossina morsitans,
 30 Haematobia irritans, Haplodiplosis equestris, Hylemyia
 platyura, Hypoderma lineata, Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii,
 Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Lycoria
 pectoralis, Mayetiola destructor, Musca domestica, Muscina
 stabulans, Oestrus ovis, Oscinella frit, Pegomya hysocyami,
 35 Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Rhagoletis
 cerasi, Rhagoletis pomonella, Tabanus bovinus, Tipula ole-
 racea und Tipula paludosa,
 - Thripse (Thysanoptera), z.B. Frankliniella fusca, Frankliniella
 40 occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips
 oryzae, Thrips palmi und Thrips tabaci,
 - Hautflügler (Hymenoptera), z.B. Athalia rosae, Atta cephalotes,
 Atta sexdens, Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testu-
 dina, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata und Solenopsis
 invicta,
 - Wanzen (Heteroptera), z.B. Acrosternum hilare, Blissus leucop-
 45 terus, Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus in-
 termedius, Eurygaster integriceps, Euschistus impictiventris,

- Leptoglossus phyllopus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis und Thyanta perditor,
- Pflanzensauger (Homoptera), z.B. Acyrthosiphon onobrychis,
 - 5 Adelges laricis, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis pomi, Aphis sambuci, Brachycaudus cardui, Brevicoryne brassicae, Cerosiphia gossypii, Dreyfusia nordmanniana, Dreyfusia piceae, Dysaphis radicola, Dysaulacorthum pseudosolani, Empoasca fabae, Macrosiphum avenae, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphon rosae,
 - 10 Megoura viciae, Metopolophium dirhodum, Myzodes persicae, Myzus cerasi, Nilaparvata lugens, Pemphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus, Rhopalosiphum maidis, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Trialeurodes vaporariorum und Viteus vitifolii,
 - Termiten (Isoptera), z.B. Calotermes flavicollis, Leucotermes flavipes, Reticulitermes lucifugus und Termes natalensis,
 - Geradflügler (Orthoptera), z.B. Acheta domestica, Blatta orientalis, Blattella germanica, Forficula auricularia, Grylotalpa grylotalpa, Locusta migratoria, Melanoplus bivittatus, Melanoplus femur-rubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Periplaneta americana, Schistocerca americana, Schistocerca peregrina, Stauronotus maroccanus und Tachycines asynamorus,
 - 20 • Arachnoidea wie Spinnentiere (Acarina), z.B. Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Argas persicus, Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus, Brevipalpus phoenicis, Bryobia praetiosa, Dermacentor silvarum, Eotetranychus carpini, Eriophyes sheldoni, Hyalomma truncatum, Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus, Ornithodoros moubata, Otobius megnini, Paratetranychus pilosus, Dermanyssus gallinae, Phyllocoptura oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes ovis, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus evertsi, Sarcoptes scabiei, Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius und Tetranychus urticae,
 - 35 • Nematoden wie Wurzelgallennematoden, z.B. Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, Zysten bildende Nematoden, z.B. Globodera rostochiensis, Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Heterodera trifolii,
 - 40 Stock- und Blattälchen, z.B. Belonolaimus longicaudatus, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci, Helicotylenchus multinctus, Longidorus elongatus, Radopholus similis, Rotylenchus robustus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus dubius, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus curvatus und Pratylenchus
 - 45 goodeyi.

Die Aufwandmenge an Wirkstoff zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen beträgt unter Freilandbedingungen 0,1 bis 2,0, vorzugsweise 0,2 bis 1,0 kg/ha.

- 5 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Ver-
- 10 bindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgier-

15 mitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B.

20 Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-

25 ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammonium-

30 umsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem

35 Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpoly-

40 etheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

- 45 Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner

- Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol,
- 5 Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.
- 10 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.
- Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate,
- 15 te, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, ge-
- 20 mahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.
- 25 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.
- 30 Beispiele für Formulierungen sind:
- I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des
- 35 Wirkstoffs enthält.
- II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man
- 40 erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
- 45 einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz

der Dodecylbenzölsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

- 5 IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).
- 10
- V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- 15
- VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 20
- VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 25
- 30
- VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 35
- 40

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Ver-

45

streuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

5

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder
10 in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung
15 mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen
20 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff
25 ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zuge-
30 setzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der
35 z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

40

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylen-
45 bisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zinkethylen-diamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide,

- Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylenbis-(thiocarbamoyl)disulfid;
- 5 • Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
- heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethylphthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyle)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 15 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
- N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäure-diamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 25 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methylfuran-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. 35 dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-ylethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-40 1,3-dioxolan-2-ylethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol, α -(2-Chlorphenyl)- α -45 (4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-

- 4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
- Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino-[α -(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetat, Methyl-E-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yl-oxyl]-phenyl}-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino-[α -(2-phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino-[α -(2,5-dimethylphenoxy)-o-tolyl]-acetamid,
 - Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin, N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
 - Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril,
 - Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid,
 - sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methyl-ester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-[3,5-Dichlorphenyl(5-methyl-5-methoxymethyl)]-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylehydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonensäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoxyimino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol.

Synthesebeispiele

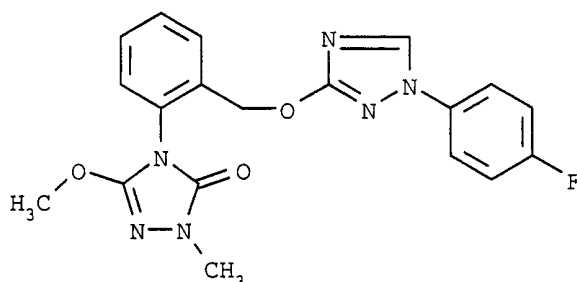
35

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

45

Beispiel 1 2,4-Dihydro-5-methoxy-2-methyl-4-{2-[1-(4-fluorphenyl)-1,2,4-triazolyl-3-]oxymethylphenyl}-3H-1,2,4-triazol-3-on [I-1]

5



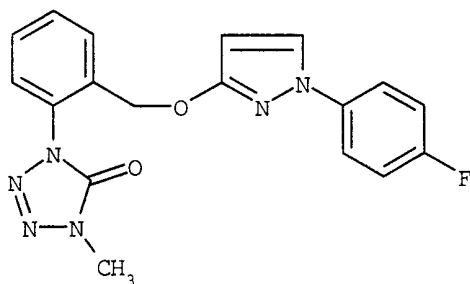
10

Eine Mischung von 0,6 g (3 mmol) (4-Fluorphenyl)-3-hydroxytriazol in 15 ml Dimethylformamid wurde mit 0,1 g (3,6 mmol) Natriumhydrid versetzt und etwa 5 min bei 20 bis 25°C gerührt. Anschließend wurde 1 g (3,3 mmol) 4-(2-Brommethylphenyl)-2,4-dihydro-5-methoxy-2-methyl-3H-1,2,4-triazol-3-on [WO-A 95/14,009] zugegeben und etwa 14 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Dann wurde Wasser zugegeben und die wässrige Phase mit Methyl-tert. Butylether extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser extrahiert, getrocknet und eingeeengt. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen 0,55 g der Titelverbindung als hellgelben Festkörper mit dem Fp 137-139°C.

25 ¹H-NMR (CDCl₃): 3,45 (s, 3H); 3,95 (s, 3H); 5,4 (s, 2H); 7,1 - 7,3 (m, 3H); 7,45 (m, 2H); 7,55 (m, 2H); 7,75 (d, br, 1H); 8,15 ppm (s, 1H).

Beispiel 2 2,5-Dihydro-2-methyl-5-{2-[1-(4-fluorphenyl)-pyrazolyl-3-]oxymethylphenyl}-tetrazolon [I-3]

30



35

Eine Lösung von 1,36 g (7 mmol) 1-(4-Fluorphenyl)-3-hydroxy-pyrazol in 25 ml wasserfreiem Dimethylformamid (DMF) wurde mit 0,18 g Natriumhydrid versetzt. Nach etwa einer Std. Rühren bei 20-25°C wurde eine Lösung von 1,88 g (7 mmol) 2,5-Dihydro-2-methyl-5-(2-Brommethylphenyl)-tetrazolon [WO-A 96/36229] in 15 ml wasserfreiem DMF zugesetzt und die Lösung für weitere 14 Std. bei 20-25°C gerührt. Die Lösung wurde nach Verdünnen mit 300 ml verd. NaCl-Lösung mit Methyl-tert. butylether (MTBE) extrahiert, dann wurden die vereinigten organischen Phasen mit Wasser gewaschen

45

und getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/MTBE 1:1) wurden 1,8 g der Titelverbindung in Form hellgelber Kristalle mit dem Fp 89-93°C erhalten.

5

Beispiel 3 2,4-Dihydro-2,5-dimethyl-4-{2-[1-(4-chlorphenyl)-pyrazolyl-3-]oxymethylphenyl}-3H-1,2,4-triazol-3-on [I-46]

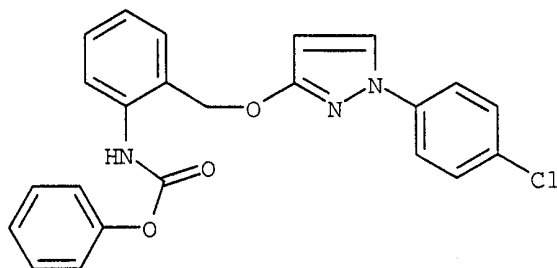
10 Beispiel 3a 2-[1-(4-Chlorphenyl)-pyrazolyl-3-]oxymethylanilin

Eine Mischung von 30 g (90 mmol) 2-[1-(4-Chlorphenyl)-pyrazolyl-3-]oxymethyl-nitrobenzol und 2 g Platin auf Aktivkohle (5%ig) in 200 ml Essigsäureethylester wurde bei 20-25°C bei einem Wasser-
15 stoffdruck von 20 bar etwa 20 Std. unter Rühren hydriert. Nach Filtration über Al₂O₃ und Abdestillieren des Lösungsmittels erhielt man aus dem Filtrat 23,3 g des Anilins als gelbe Kristalle vom Fp. 81-83°C.

20 ¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 7,65 (d, 1H); 7,5 (d, 2H); 7,35 (d, 2H); 7,25 (d, 1H); 7,15 (t, br, 1H); 6,7 (m, 2H); 5,9 (d, 1H); 5,25 (s, 2H); 4,15 (s, br, 2H).

Beispiel 3b 2-[1-(4-Chlorphenyl)-pyrazolyl-3-]oxymethylphenyl-carbaminsäurephenylester
25

30



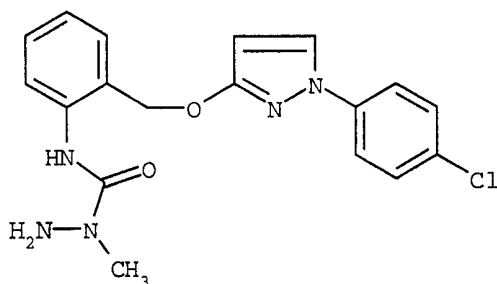
Eine Mischung des Anilins aus Beispiel 3a und 12 g (0,15 mol) Pyridin in 200 ml Methylenchlorid wurde nach Versetzen mit 16 g
35 (0,1 mol) Phenylchlorformiat bei 0°C etwa 1,5 Std. bei 20-25°C gerührt. Nach Waschen mit verd. Salzsäure und Wasser und Trocknen wurde das Lösungsmittel abdestilliert. Nach Digerieren in Diisopropylether erhielt man aus dem Rückstand 41 g der Titelverbin-
40 dung als hellgelbe Kristalle vom Fp. 143-144°C.

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 8,95 (s, br, 1H); 7,95 (d, br, 2H); 7,65 (d, 1H); 7,55 (d, 2H); 7,45 (d, 1H); 7,05-7,45 (m, 9H); 5,9 (d, 1H); 5,4 (s, 2H).

45

Beispiel 3c N-{2-[1-(4-Chlorphenyl)-pyrazolyl-3-]oxymethylphenyl}-N'-methyl-semicarbazid

5



10

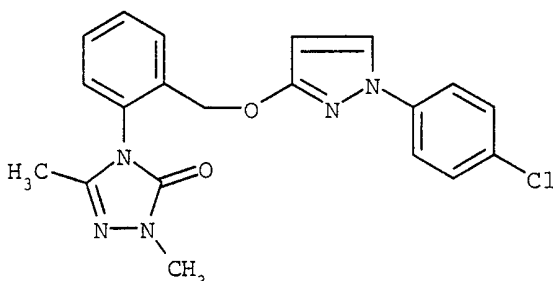
Eine Mischung des Esters aus Beispiel 3b und 3,5 g (75 mmol) Methylhydrazin in 100 ml Methylenchlorid wurde etwa 15 Std. bei 20-25°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Digerieren des Rückstandes in Methyl-tert.-butylether (MTBE) erhielt man 6,5 g der Titelverbindung als hellgelbe Kristalle vom Fp. 152-154°C.

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 9,3 (s, br, 1H); 8,1 (d, 1H); 7,7 (d, 1H); 7,65 (d, 2H); 7,35 (m, 4H); 7,0 (t, 1H); 5,9 (d, 1H); 5,3 (s, 2H); 3,7 (s, 2H); 3,2 (s, 3H).

20

Beispiel 3d 2,4-Dihydro-2,5-dimethyl-4-{2-[1-(4-chlorphenyl)-pyrazolyl-3-]oxymethylphenyl}-3H-1,2,4-triazol-3-on [I-46]

25



30

Eine Mischung von 6 g (16 mmol) des Semicarbazids aus Beispiel 3c auf einer Spatelspitze p-Toluolsulfonsäure in 50 ml Triethylorthoacetat wurde etwa 5 Std. refluxiert. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Essigsäureethylester-Gemisch) erhielt man 1,9 g der Titelverbindung als gelbe Kristalle vom Fp. 107-108°C.

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 7,7 (m, 2H); 7,5 (m, 4H); 7,35 (d, 2H); 7,2 (d, 1H); 5,85 (d, 1H); 5,25 (dd, 2H); 3,45 (s, 3H); 2,0 (s, 3H).

45

Tabelle I

	Nr.	Formel	(R ¹) _n	R ^a	R ^b	Y	R ²	R ³	Fp [°C], IR [cm ⁻¹]
5	I-1	IB	H	OCH ₃	CH ₃	N	H	4-F-C ₆ H ₄	137-139
	I-2	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	4-Cl-C ₆ H ₄	1723, 1615, 1546, 1502, 1480, 1458, 1414, 1390, 1360, 744
10	I-3	IC	H	-	CH ₃	CH	H	4-F-C ₆ H ₄	89-93
	I-4	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	3,4-Cl ₂ - C ₆ H ₄	120-123
	I-5	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	146-149
15	I-6	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	106-108
	I-7	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	2-CH ₃ - Pyridyl-6	115-118
20	I-8	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	2-CH ₃ - Pyridyl-6	1725, 1615, 1581, 1547, 1505, 1480, 1466, 1414, 1390, 1360
	I-9	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	4-OC ₂ H ₅ - C ₆ H ₄	128-135
25	I-10	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	4-OC ₂ H ₅ - C ₆ H ₄	1723, 1615, 1543, 1516, 1481, 1457, 1414, 1392, 1247, 1050
	I-11	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	3-Cl-C ₆ H ₄	104-109
30	I-12	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	3-Cl-C ₆ H ₄	116-118
	I-13	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	2-Cl-C ₆ H ₄	1728, 1545, 1495, 1476, 1452, 1396, 1360, 761, 737, 621
35	I-14	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	2-Cl-C ₆ H ₄	1725, 1615, 1546, 1495, 1477, 1452, 1414, 1361, 761, 743
40	I-15	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	2,4-F ₂ - C ₆ H ₃	100-103
	I-16	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	2,4-F ₂ - C ₆ H ₃	1725, 1615, 1550, 1517, 1482, 1457, 1446, 1415, 1270, 970
45	I-17	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	3-Cl- Pyridyl-6	85-94

Nr.	Formel	(R ¹) _n	R ^a	R ^b	Y	R ²	R ³	Fp [°C], IR [cm ⁻¹]
5	I-18	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	3-Cl-Pyridyl-6 121-129
	I-19	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ 111-117
10	I-20	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ 1717, 1613, 1556, 1507, 1477, 1455, 1357, 1332, 1170, 1115
	I-21	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	4-Br-C ₆ H ₄ 1726, 1546, 1499, 1480, 1458, 1421, 1392, 1358, 1076, 935
15	I-22	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	4-Br-C ₆ H ₄ 1724, 1615, 1547, 1499, 1480, 1457, 1414, 1389, 1360, 1077
20	I-23	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₄ 1728, 1546, 1496, 1475, 1458, 1417, 1397, 1358, 1059, 763
25	I-24	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₄ 1725, 1615, 1547, 1496, 1477, 1414, 1389, 1359, 1321, 744
30	I-25	IB	H	Cl	CH ₃	CH	H	C ₂ H ₅ 1727, 1538, 1490, 1459, 1397, 1380, 1365, 765, 737, 621
35	I-26	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	C ₂ H ₅ 1724, 1615, 1536, 1505, 1489, 1458, 1414, 1388, 1321, 743
40	I-27	IB	H	Cl	CH ₃	C(CH ₃)	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ 119-130
	I-28	IB	H	OCH ₃	CH ₃	C(CH ₃)	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ 1725, 1615, 1519, 1506, 1480, 1457, 1414, 1361, 1199, 941
	I-29	IB	H	Cl	CH ₃	C(CH ₃)	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₄ 81-85
45	I-30	IB	H	OCH ₃	CH ₃	C(CH ₃)	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₄ 141-145

	Nr.	Formel	(R ¹) _n	R ^a	R ^b	Y	R ²	R ³	Fp [°C], IR [cm ⁻¹]
5	I-31	IB	H	Cl	CH ₃	C(CH ₃)	H	C ₆ H ₅	1729, 1599, 1540, 1500, 1466, 1398, 1363, 1197, 763, 756
	I-32	IB	H	OCH ₃	CH ₃	C(CH ₃)	H	C ₆ H ₅	134-137
	I-33	IB	H	Cl	CH ₃	CCl	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	130-133
10	I-34	IB	H	OCH ₃	CH ₃	CCl	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	1723, 1615, 1554, 1510, 1479, 1457, 1414, 1390, 1361, 1118
15	I-35	IB	H	Cl	CH ₃	N	H	4-Cl-C ₆ H ₄	1726, 1544, 1500, 1480, 1458, 1397, 1330, 1242, 1093, 974
20	I-36	IB	H	OCH ₃	CH ₃	N	H	4-Cl-C ₆ H ₄	1706, 1619, 1603, 1547, 1486, 1477, 1336, 1326, 1083, 980
25	I-37	IB	H	Cl	CH ₃	N	H	2,4-Cl ₂ - C ₆ H ₄	1726, 1544, 1494, 1477, 1457, 1396, 1331, 1274, 1065, 994
30	I-38	IB	H	OCH ₃	CH ₃	N	H	2,4-Cl ₂ - C ₆ H ₄	1723, 1616, 1545, 1479, 1457, 1414, 1388, 1330, 1066, 974
35	I-39	IB	H	Cl	CH ₃	N	H	3,4-(CH ₃) ₂ - C ₆ H ₃	1728, 1542, 1505, 1481, 1458, 1397, 1330, 1243, 1065, 994
	I-40	IB	H	OCH ₃	CH ₃	N	H	3,4-(CH ₃) ₂ - C ₆ H ₃	127-131
	I-41	IB	H	Cl	CH ₃	N	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	134-145
40	I-42	IB	H	OCH ₃	CH ₃	N	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	145-149
	I-43	IB	H	Cl	CH ₃	N	CH ₃	2,4-Cl ₂ - C ₆ H ₄	1728, 1540, 1488, 1457, 1419, 1396, 1349, 1274, 1018, 994

45

	Nr.	Formel	(R ¹) _n	R ^a	R ^b	Y	R ²	R ³	Fp [°C], IR [cm ⁻¹]
5	I-44	IB	H	OCH ₃	CH ₃	N	CH ₃	2,4-Cl ₂ - C ₆ H ₄	1724, 1616, 1541, 1502, 1480, 1457, 1415, 1389, 1350, 1068
10	I-45	IA	H	OCH ₃	CH ₃	CH	H	4-Cl-C ₆ H ₄	1641, 1603, 1546, 1502, 1481, 1400, 1383, 1359, 1028, 936
15	I-46	IB	6-CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH	H	4-Cl-C ₆ H ₄	1722, 1613, 1546, 1502, 1488, 1502, 1425, 1413, 1390, 1358, 1070
	I-47	IB	H	CH ₃	CH ₃	CH	H	4-Cl-C ₆ H ₄	107-109
	I-48	IB	6-CH ₃	H	CH ₃	CH	H	4-Cl-C ₆ H ₄	126-128
20	I-49	IB	H	H	CH ₃	CH	H	4-Cl-C ₆ H ₄	130-132
	I-50	IB	6-CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH	H	4-Cl-C ₆ H ₄	120-124

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

- 25 Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion in einem Gemisch aus 63 Gew.-% Cyclohexanon, 27 Gew.-% Emulgator aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

30

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen *Plasmopara viticola*

- 35 Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die mit einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Um die Dauerwirkung der Substanzen beurteilen zu können, wurden die Pflanzen nach dem An-
- 40 trocknen des Spritzbelages für 7 Tage im Gewächshaus aufgestellt. Erst dann wurden die Blätter mit einer wäßrigen Zoosporenaufschwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für 5 Tage im Gewächshaus bei
- 45 Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in eine feuchte Kammer gestellt.

Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 16 ppm der Verbindungen Nr. I-2, I-4, I-6, I-8, I-10, I-12, I-16, I-18, I-20, I-22, I-24, I-28, I-32, I-38 und I-44 behandelten Pflanzen maximal 15 % Befall, während die Unbehandelten zu 75 % befallen waren.

10 Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen *Puccinia recondita* an Weizen (Weizenbraunrost)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizensämlingen der Sorte "Frühgold" wurden mit Sporen des Braunrostes (*Puccinia recondita*) bestäubt. Danach wurden die Töpfe für 24 Stunden in eine Kammer mit hoher Luftfeuchtigkeit (90 bis 95 %) und 20 bis 22°C gestellt. Während dieser Zeit keimten die Sporen aus und die Keimschläuche drangen in das Blattgewebe ein. Die infizierten Pflanzen wurden am nächsten Tag mit einer wäßrigen Wirkstoffaufbereitung tropfnaß besprüht. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C und 65 bis 70 % relativer Luftfeuchte für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Rostpilzentwicklung auf den Blättern ermittelt.

25 In diesem Test zeigten die mit 16 ppm der Verbindungen Nr. I-2, I-4, I-6, I-16, I-22, I-24, I-28, I-32 und I-38 behandelten Pflanzen nicht über 15 % Befall, während die Unbehandelten zu 80 % befallen waren.

30 Anwendungsbeispiel 3 - Wirksamkeit gegen *Pyricularia oryzae* (protektiv)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Reiskeimlingen der Sorte "Tai-Nong 67" wurden mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung bis zur Tropfnäße besprüht. Am folgenden Tag wurden die Pflanzen einer wäßrigen Sporensuspension von *Pyricularia oryzae* inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in Klimakammern bei 22 - 24°C und 95 - 99% relativer Luftfeuchtigkeit für 6 Tage aufgestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blättern visuell ermittelt.

45 In diesem Test zeigten die mit 16 ppm der Verbindungen Nr. I-2, I-6, I-12, I-16, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-28, I-30, I-32 und I-40 behandelten Pflanzen 0 bis 15 % Befall, während die Unbehandelten zu 90 % befallen waren.

Beispiele für die Wirkung gegen tierische Schädlinge

Die Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I gegen tierische Schädlinge ließ sich durch folgende Versuche zeigen:

5

Die Wirkstoffe wurden

- a. als 0,1%-ige Lösung in Aceton oder
- b. als 10%-ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol® EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl)

10

aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Aceton im Fall von a. bzw. mit Wasser im Fall von b. verdünnt.

15

Nach Abschluß der Versuche wurde die jeweils niedrigste Konzentration ermittelt, bei der die Verbindungen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollversuchen noch eine 80 bis 100%-ige Hemmung bzw. Mortalität hervorriefen (Wirkschwelle bzw. Minimalkonzentration).

20

25

30

35

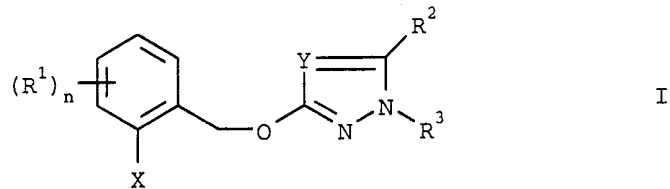
40

45

Patentansprüche:

1. 2-[Pyrazolyl- und Triazolyl-3'-oxymethylen]-phenyl-isoxaz-
5 lone, -triazolone und -tetrazolone der Formel I

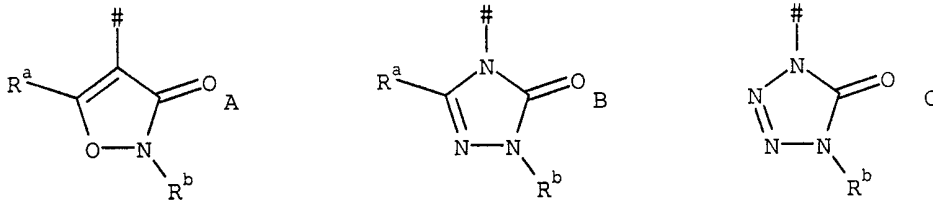
10



in der die Indices und die Substituenten die folgende Bedeu-
15 tung haben:

- 15 X eine Gruppe A, B oder C,

20



wobei

25

die Bindung mit dem Phenylring kennzeichnet und

R^a für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Al-
koxy und

R^b für C₁-C₄-Alkyl steht;

30

Y N oder CR^c, wobei

R^c für Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl steht;

35

n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden
sein können, wenn n größer als 1 ist;

R¹ Nitro, Cyano, Halogen,

40

ggf. subst. C₁-C₆-Alkyl oder ggf. subst. C₁-C₄-Alkoxy oder

45

für den Fall, daß n für 2 steht, zusätzlich eine an zwei
benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, wel-
che drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlen-
stoffatome, 2 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stick-
stoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei

diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;

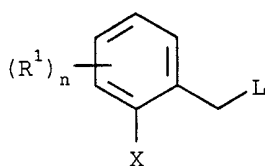
5 R^2 Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl;

R^3 ggf. subst. C_1 - C_6 -Alkyl, ggf. subst. C_3 - C_6 -Cycloalkyl, ggf. subst. Aryl oder ggf. subst. Hetaryl.

10

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Benzylderivat der Formel II,

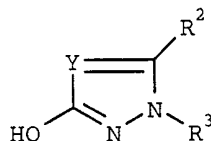
15



II

in der L eine nucleophil austauschbare Gruppe bedeutet, in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxypyrazol oder -triazol der Formel III,

20



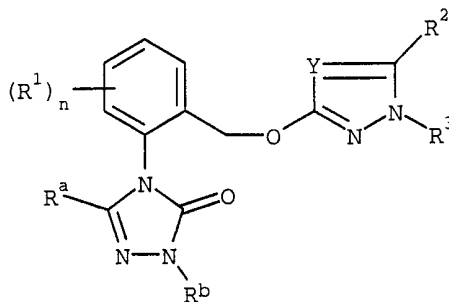
III

25

umsetzt.

3. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel IB,

30

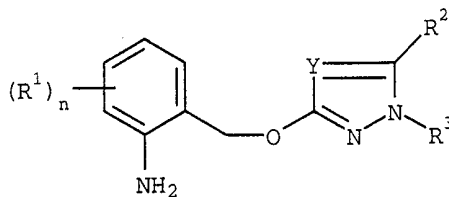


IB

35

in denen R^a für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy steht, und Y, R^b , R^c , R^1 , n , R^2 und R^3 die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben, dadurch gekennzeichnet, daß man Aniline der Formel IIa

40

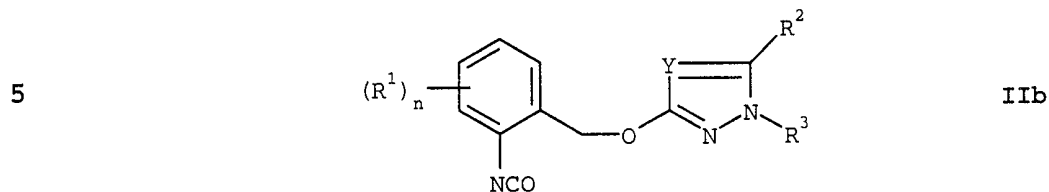


IIa

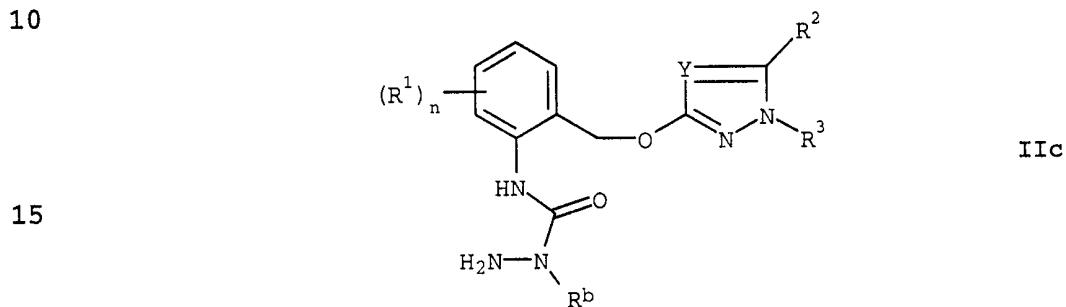
45

57

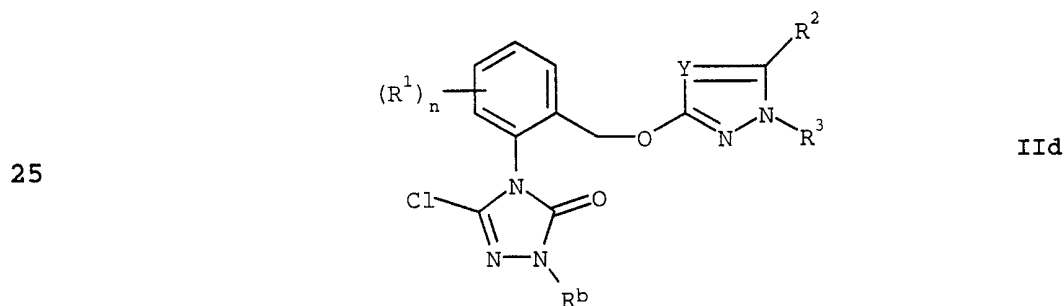
mit Phosgen oder einem Phosgenäquivalent zu Isocyanaten der Formel IIb



und IIb mit C₁-C₄-Alkylhydrazinen zu Carbamaten der Formel IIc



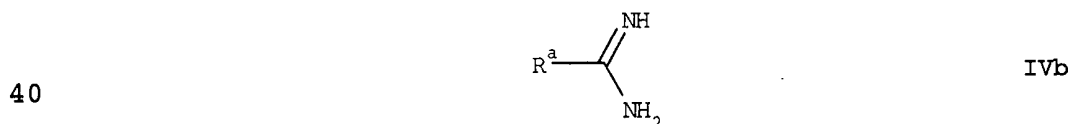
umsetzt, IIc mit Phosgen oder einem Phosgenäquivalent zu Triazolonen der Formel IIId



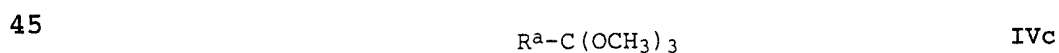
30 cyclisiert und IIId entweder durch Umsetzung mit Alkoholen der Formel IVa,



35 wobei R^e für C₁-C₄-Alkyl steht, in Triazolone der Formel IB, in der R^a für C₁-C₄-Alkoxy steht, oder durch Umsetzung mit Amidinen der Formel IVb,



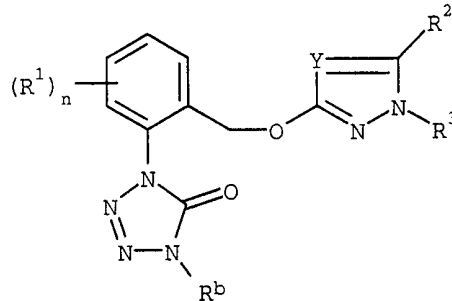
in der R^a für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy steht, oder mit Orthoestern der Formel IVc,



in der R^a für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy steht, in Triazolone der Formel IB, in der R^a für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy steht, überführt.

5 4. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel IC,

10

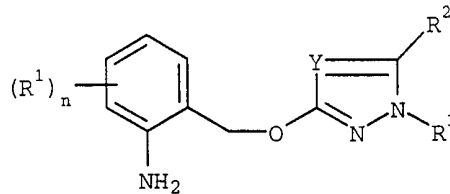


IC

15

in denen Y, R^b , R^c , R^1 , n, R^2 und R^3 die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben, dadurch gekennzeichnet, daß man Aniline der Formel IIa

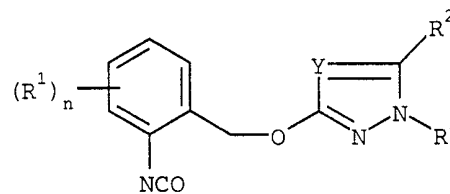
20



IIa

mit Phosgen oder einem Phosgenäquivalent zu Isocyanaten der Formel IIb

25



IIb

30

und IIb mit Aziden der Formel IVd,



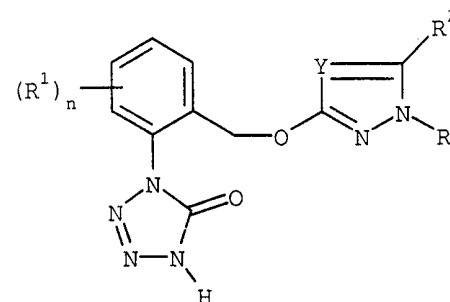
IVd

35

wobei M für ein Kation aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Trialkylsilyl oder Alkyl steht,

zu Tetrazolonen der Formel IIe

40



IIe

45

umsetzt und IIe durch Alkylierung in Verbindungen der Formel IC überführt.

5. Zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen
5 geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
6. Verwendung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1 zur Herstel-
10 lung eines zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen geeigneten Mittels.
7. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekenn-
15 zeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.
8. Verfahren zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, dadurch
20 gekennzeichnet, daß man die tierischen Schädlinge oder die vor ihnen zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

25

30

35

40

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 98/04096

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07D403/12 C07D413/12 A01N43/647 A01N43/713 C07D401/14

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D A01N

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

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 96 38425 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LTD.) 5 December 1996 cited in the application see claims 1-11 ---	1-8
Y	WO 95 14009 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.) 26 May 1995 cited in the application see claims 1-10 ---	1-8
Y	WO 96 01256 A (BASF AG) 18 January 1996 cited in the application see claims 1-11 ---	1-8
Y	WO 96 01258 A (BASF AG) 18 January 1996 cited in the application see claims 1-11 ---	1-8
	-/--	

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

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

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

Date of the actual completion of the international search

14 October 1998

Date of mailing of the international search report

21/10/1998

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Herz, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 98/04096

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 95 29896 A (BASF AG) 9 November 1995 cited in the application see claims 1-10 -----	1-8
Y	WO 96 35690 A (BASF AG) 14 November 1996 see claims 1-12 -----	1-8
Y	WO 97 05120 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LTD.) 13 February 1997 cited in the application see claims 1-15 -----	1-8
Y	WO 96 36229 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.) 21 November 1996 cited in the application see claims 1-11 -----	1-8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Int. Application No

PCT/EP 98/04096

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9638425 A	05-12-1996	JP 9048766 A	18-02-1997
		AU 5781296 A	18-12-1996
		JP 9048767 A	18-02-1997

WO 9514009 A	26-05-1995	AU 677448 B	24-04-1997
		AU 7953594 A	06-06-1995
		BR 9408167 A	26-08-1997
		CN 1141035 A	22-01-1997
		CZ 9601379 A	11-12-1996
		EP 0729461 A	04-09-1996
		HU 74367 A	30-12-1996
		JP 9506341 T	24-06-1997
		LT 96071 A, B	27-12-1996
		LV 11616 A	20-12-1996
		LV 11616 B	20-06-1997
		PL 315747 A	25-11-1996
		SI 9420064 A	28-02-1997
		SK 64596 A	05-02-1997
		US 5747516 A	05-05-1998
		ZA 9409141 A	17-05-1996

WO 9601256 A	18-01-1996	DE 4423612 A	11-01-1996
		AU 685299 B	15-01-1998
		AU 2922295 A	25-01-1996
		BG 101198 A	30-01-1998
		BR 9508242 A	30-09-1997
		CA 2194503 A	18-01-1996
		CZ 9700037 A	17-06-1998
		EP 0804421 A	05-11-1997
		FI 970067 A	05-03-1997
		HU 77510 A	28-05-1998
		JP 10504810 T	12-05-1998
		NO 970042 A	05-03-1997
		PL 318100 A	12-05-1997

WO 9601258 A	18-01-1996	DE 4423613 A	11-01-1996
		AU 688536 B	12-03-1998
		AU 2886395 A	25-01-1996
		BG 101196 A	29-08-1997
		BR 9508241 A	02-06-1998

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No PCT/EP 98/04096

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date		
WO 9601258 A		CA 2194502 A	18-01-1996		
		CN 1156992 A	13-08-1997		
		CZ 9700021 A	15-04-1998		
		EP 0769010 A	23-04-1997		
		HU 76657 A	28-10-1997		
		JP 10504809 T	12-05-1998		
		PL 318111 A	12-05-1997		
WO 9529896 A	09-11-1995	AU 682963 B	23-10-1997		
		AU 2448195 A	29-11-1995		
		BR 9507602 A	07-10-1997		
		CN 1150800 A	28-05-1997		
		CZ 9603205 A	11-06-1997		
		EP 0758322 A	19-02-1997		
		JP 9512541 T	16-12-1997		
		US 5707936 A	13-01-1998		
		WO 9635690 A	14-11-1996	AU 5648496 A	29-11-1996
CA 2217778 A	14-11-1996				
CN 1183783 A	03-06-1998				
EP 0824533 A	25-02-1998				
HU 9801135 A	28-08-1998				
WO 9705120 A	13-02-1997	JP 9095486 A	08-04-1997		
		AU 6531196 A	26-02-1997		
WO 9636229 A	21-11-1996	NONE			

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04096

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07D403/12 C07D413/12 A01N43/647 A01N43/713 C07D401/14

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 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)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 96 38425 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LTD.) 5. Dezember 1996 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1-11 ---	1-8
Y	WO 95 14009 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.) 26. Mai 1995 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1-10 ---	1-8
Y	WO 96 01256 A (BASF AG) 18. Januar 1996 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1-11 ---	1-8
Y	WO 96 01258 A (BASF AG) 18. Januar 1996 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1-11 ---	1-8
	-/--	

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

14. Oktober 1998

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

21/10/1998

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Herz, C

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04096

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie ³	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 95 29896 A (BASF AG) 9. November 1995 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1-10 ---	1-8
Y	WO 96 35690 A (BASF AG) 14. November 1996 siehe Ansprüche 1-12 ---	1-8
Y	WO 97 05120 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LTD.) 13. Februar 1997 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1-15 ---	1-8
Y	WO 96 36229 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.) 21. November 1996 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1-11 -----	1-8

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04096

Im Recherchenbericht angeführtes Patendokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9638425 A	05-12-1996	JP 9048766 A	18-02-1997
		AU 5781296 A	18-12-1996
		JP 9048767 A	18-02-1997
WO 9514009 A	26-05-1995	AU 677448 B	24-04-1997
		AU 7953594 A	06-06-1995
		BR 9408167 A	26-08-1997
		CN 1141035 A	22-01-1997
		CZ 9601379 A	11-12-1996
		EP 0729461 A	04-09-1996
		HU 74367 A	30-12-1996
		JP 9506341 T	24-06-1997
		LT 96071 A, B	27-12-1996
		LV 11616 A	20-12-1996
		LV 11616 B	20-06-1997
		PL 315747 A	25-11-1996
		SI 9420064 A	28-02-1997
		SK 64596 A	05-02-1997
		US 5747516 A	05-05-1998
		ZA 9409141 A	17-05-1996
WO 9601256 A	18-01-1996	DE 4423612 A	11-01-1996
		AU 685299 B	15-01-1998
		AU 2922295 A	25-01-1996
		BG 101198 A	30-01-1998
		BR 9508242 A	30-09-1997
		CA 2194503 A	18-01-1996
		CZ 9700037 A	17-06-1998
		EP 0804421 A	05-11-1997
		FI 970067 A	05-03-1997
		HU 77510 A	28-05-1998
		JP 10504810 T	12-05-1998
		NO 970042 A	05-03-1997
		PL 318100 A	12-05-1997
WO 9601258 A	18-01-1996	DE 4423613 A	11-01-1996
		AU 688536 B	12-03-1998
		AU 2886395 A	25-01-1996
		BG 101196 A	29-08-1997
		BR 9508241 A	02-06-1998

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04096

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9601258 A		CA 2194502 A	18-01-1996
		CN 1156992 A	13-08-1997
		CZ 9700021 A	15-04-1998
		EP 0769010 A	23-04-1997
		HU 76657 A	28-10-1997
		JP 10504809 T	12-05-1998
		PL 318111 A	12-05-1997
WO 9529896 A	09-11-1995	AU 682963 B	23-10-1997
		AU 2448195 A	29-11-1995
		BR 9507602 A	07-10-1997
		CN 1150800 A	28-05-1997
		CZ 9603205 A	11-06-1997
		EP 0758322 A	19-02-1997
		JP 9512541 T	16-12-1997
		US 5707936 A	13-01-1998
		WO 9635690 A	14-11-1996
CA 2217778 A	14-11-1996		
CN 1183783 A	03-06-1998		
EP 0824533 A	25-02-1998		
HU 9801135 A	28-08-1998		
WO 9705120 A	13-02-1997	JP 9095486 A	08-04-1997
		AU 6531196 A	26-02-1997
WO 9636229 A	21-11-1996	KEINE	