

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

(19) Weltorganisation für geistiges
Eigentum

Internationales Büro

(43) Internationales
Veröffentlichungsdatum
31. August 2017 (31.08.2017)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2017/144402 A1

- (51) **Internationale Patentklassifikation:**
C07D 271/113 (2006.01) A01N 43/82 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
- (21) **Internationales Aktenzeichen:** PCT/EP2017/053763
- (22) **Internationales Anmeldedatum:**
20. Februar 2017 (20.02.2017)
- (25) **Einreichungssprache:** Deutsch
- (26) **Veröffentlichungssprache:** Deutsch
- (30) **Angaben zur Priorität:**
16157057.7 24. Februar 2016 (24.02.2016) EP
- (71) **Anmelder:** BAYER CROPSCIENCE
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str.
50, 40789 Monheim am Rhein (DE).
- (72) **Erfinder:** KÖHN, Arnim; Ringstr. 12, 55270 Klein-
Winternheim (DE). WALDRAFF, Christian; Franz-
Lehar-Weg 7, 61118 Bad Vilbel (DE). AHRENS,
Hartmut; Auf der Höhe 14, 63329 Egelsbach (DE).
DIETRICH, Hansjörg; Bonifatiusstr. 1b, 65835
Liederbach (DE). GATZWEILER, Elmar; Am
Nauheimer Bach 22, 61231 Bad Nauheim (DE).
ROSINGER, Christopher; Am Hochfeld 33, 65719
Hofheim (DE). TIEBES, Jörg; Am Schwalbenschwanz
25, 60431 Frankfurt (DE). SAUSEN, Armin; Langstr. 87,
61276 Weilrod (DE).
- (74) **Anwalt:** BIP PATENTS; Alfred-Nobel-Str. 10, 40789
Monheim am Rhein (DE).
- (81) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW,
BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK,
DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KH,
KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY,
MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA,
NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO,
RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV,
SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC,
VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST,
SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG,
KZ, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH,
CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE,
IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO,
RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

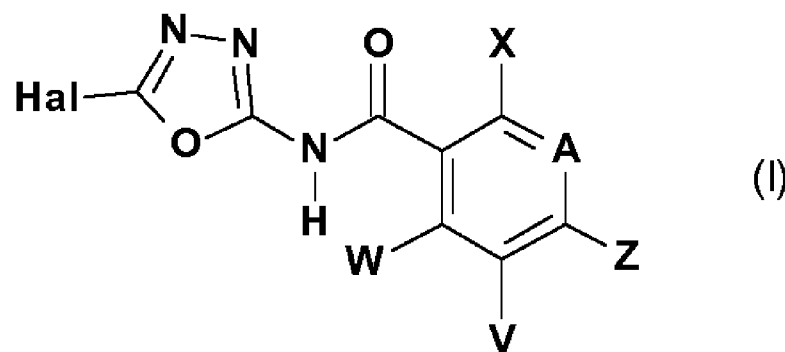
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz
3)

(54) **Title:** N-(5-HALOGEN-1,3,4-OXADIAZOL-2-YL)ARYL CARBOXYLIC ACID AMIDES AND THE USE THEREOF AS
HERBICIDES

(54) **Bezeichnung :** N-(5-HALOGEN-1,3,4-OXADIAZOL-2-YL)ARYLCARBONSÄUREAMIDE UND IHRE VERWENDUNG
ALS HERBIZIDE



(57) **Abstract:** The invention relates to N-(5-halogen-1,3,4-oxadiazol-2-yl)aryl carboxylic acid amides of general formula (I) and their use as herbicides. In formula (I), A means nitrogen or CY. R, V, W, X, Y and Z stand for groups such as hydrogen, organic groups such as alkyl, and other groups such as halogen.

(57) **Zusammenfassung:** Es werden N-(5-Halogen-1,3,4-Oxadiazol-2-yl)arylcarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I) als Herbizide beschrieben. In dieser Formel (I) bedeutet A Stickstoff oder CY. R, V, W, X, Y und Z stehen für Reste wie Wasserstoff, organische Reste wie Alkyl, und andere Reste wie Halogen.

WO 2017/144402 A1

N-(5-Halogen-1,3,4-oxadiazol-2-yl)arylcarbonsäureamide und ihre Verwendung als Herbizide

Die Erfindung betrifft das technische Gebiet der Herbizide, insbesondere das der Herbizide zur selektiven Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen.

5

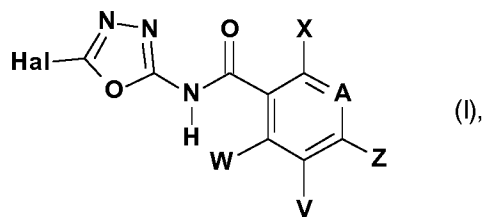
Aus WO 2012/126932 A1 sind herbizid wirksame N-(1,3,4-Oxadiazol-3-yl)arylcarboxamide bekannt, die in 5-Position des Oxadiazolrings ein Wasserstoffatom oder einen über ein Kohlenstoffatom gebundenen Rest tragen. Aus WO 2001/002354 A1 sind N-Heterocyclylphthalamide als Insektizide bekannt. Dort wird auch die unter der CAS-Nr. 1323324-77-1 bekannte Verbindung N¹-(5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-N²,N²-diethyl-3-iodphthalamid offenbart.

10

Aufgabe vorliegender Erfindung war die Bereitstellung weiterer herbizid wirksamer Verbindungen. Gelöst wurde diese Aufgabe durch Bereitstellung von N-(1,3,4-Oxadiazol-2-yl)arylcarbonsäureamiden, die in 5-Position des Oxadiazolrings ein Halogenatom tragen.

15

Ein Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind somit N-(5-Halogen-1,3,4-Oxadiazol-2-yl)arylcarbonsäureamide der Formel (I) und deren Salze



20 worin die Substituenten folgende Bedeutungen haben:

A bedeutet N oder CY,

Hal bedeutet Halogen,

25

X bedeutet Nitro, Halogen, Cyano, Formyl, Rhodano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, Halogen-(C₃-C₆)-alkinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂,

30 C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-Alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl, wobei die beiden letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der

Gruppe bestehend aus Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy und Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

Y bedeutet Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkenyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-Alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CN, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-Phenyl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl, Phenyl, Heteroaryl oder Heterocyclyl, wobei die 6 letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl und Cyanomethyl substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

Z bedeutet Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-Alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, Heteroaryl, Heterocyclyl oder Phenyl, wobei die drei letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy und Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt, oder

V bedeutet Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Halogenalkyl, OR¹, S(O)_nR²,

W bedeutet Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Halogenalkyl, OR¹, S(O)_nR²,

R¹ bedeutet Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkenyl, (C₃-C₆)-Halogenocycloalkyl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Phenyl,

Heterocyclyl bedeutet einen gesättigten, teilgesättigten oder vollständig ungesättigten cyclischen Rest, der 3 bis 6 Ringatome enthält, von denen 1 bis 4 aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel stammen, und der zusätzlich durch einen Benzoring annelliert sein kann. Beispielsweise steht Heterocyclyl für Piperidinyl, Pyrrolidinyl, Tetrahydrofuranyl, Dihydrofuranyl und Oxetanyl.

5

Heteroaryl bedeutet einen aromatischen cyclischen Rest, der 3 bis 6 Ringatome enthält, von denen 1 bis 4 aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel stammen, und der zusätzlich durch einen Benzoring annelliert sein kann. Beispielsweise steht Heteroaryl für Benzimidazol-2-yl, Furanyl, Imidazolyl, Isoxazolyl, Isothiazolyl, Oxazolyl, Pyrazinyl, Pyrimidinyl, Pyridazinyl, Pyridinyl, Benzisoxazolyl, Thiazolyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Thiophenyl, 1,2,3-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, 1,2,5-Oxadiazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl, 1,2,4-Triazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1,2,5-Triazolyl, 1,3,4-Triazolyl, 1,2,4-Triazolyl, 1,2,4-Thiadiazolyl, 1,3,4-Thiadiazolyl, 1,2,3-Thiadiazolyl, 1,2,5-Thiadiazolyl, 2H-1,2,3,4-Tetrazolyl, 1H-1,2,3,4-Tetrazolyl, 1,2,3,4-Oxatriazolyl, 1,2,3,5-Oxatriazolyl, 1,2,3,4-Thiatriazolyl und 1,2,3,5-Thiatriazolyl.

15

Ist eine Gruppe mehrfach durch Reste substituiert, so ist darunter zu verstehen, daß diese Gruppe durch ein oder mehrere gleiche oder verschiedene der genannten Reste substituiert ist.

20

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können je nach Art und Verknüpfung der Substituenten als Stereoisomere vorliegen. Sind beispielsweise ein oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome vorhanden, so können Enantiomere und Diastereomere auftreten. Ebenso treten Stereoisomere auf, wenn n für 1 steht (Sulfoxide). Stereoisomere lassen sich aus den bei der Herstellung anfallenden Gemischen nach üblichen Trennmethoden, beispielsweise durch chromatographische Trennverfahren, erhalten. Ebenso können Stereoisomere durch Einsatz stereoselektiver Reaktionen unter Verwendung optisch aktiver Ausgangs- und/oder Hilfsstoffe selektiv hergestellt werden. Die Erfindung betrifft auch alle Stereoisomeren und deren Gemische, die von der allgemeinen Formel (I) umfasst, jedoch nicht spezifisch definiert sind.

25

30

Bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin

A bedeutet N oder CY,

Hal bedeutet Chlor,

35

X bedeutet Nitro, Halogen, Cyano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, OR¹, S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, (C₁-C₆)-

Alkyl-Heterocyclyl, wobei die beiden letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy und Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

- 5 Y Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, OR¹, S(O)_nR², SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-Alkyl-Phenyl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl, Phenyl, Heteroaryl oder Heterocyclyl, wobei die 6 letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus
- 10 Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl und Cyanomethyl substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

- Z bedeutet Wasserstoff, Halogen, Methyl, Ethyl, Isopropyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, S(O)_nR² oder
- 15

V bedeutet Wasserstoff,

W bedeutet Wasserstoff,

20

- R¹ bedeutet Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-(C₁-C₆)-alkyl, Phenyl, Phenyl-(C₁-C₆)-alkyl, Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-NR³-Heteroaryl oder (C₁-C₆)-Alkyl-NR³-Heterocyclyl, wobei
- 25 die 16 letztgenannten Reste durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Halogen, Nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ und (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₂-C₆)-alkoxycarbonyl substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

- R² bedeutet (C₁-C₆)-Alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl oder (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, wobei diese
- 30 drei vorstehend genannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen und OR³ substituiert sind,

R³ bedeutet Wasserstoff oder (C₁-C₆)-Alkyl,

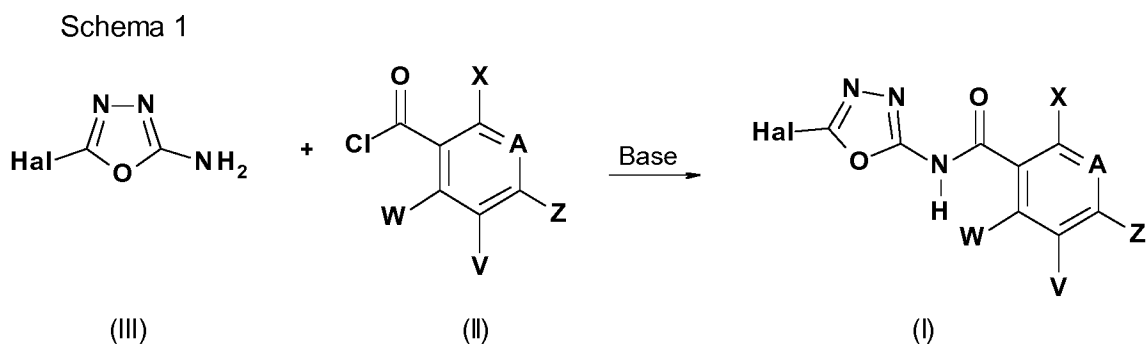
- 35 R⁴ bedeutet (C₁-C₆)-Alkyl,

n bedeutet 0, 1 oder 2,

s bedeutet 0, 1, 2 oder 3.

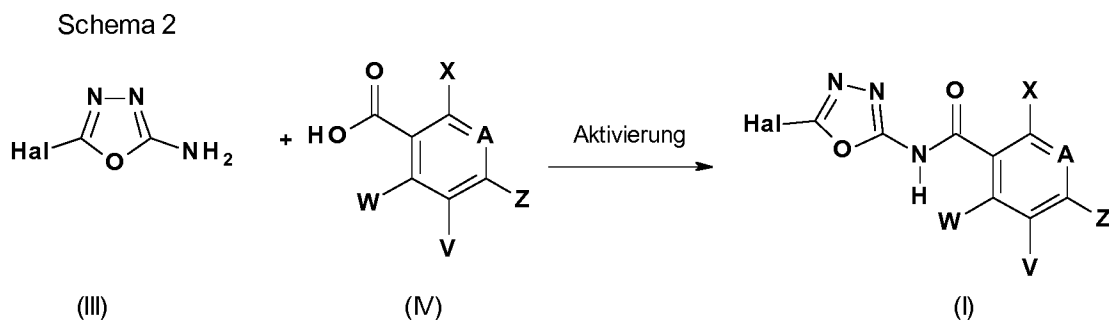
- 5 In allen nachfolgend genannten Formeln haben die Substituenten und Symbole, sofern nicht anders definiert, dieselbe Bedeutung wie unter Formel (I) beschrieben.

Erfindungsgemäße Verbindungen können beispielsweise nach der in Schema 1 angegebenen Methode durch basenkatalysierte Umsetzung eines Benzoesäure- bzw. Nicotinsäurechlorids (II) mit einem 2-Amino-1,3,4-oxadiazol (III) hergestellt werden:



Die Benzoesäurechloride der Formel (II) beziehungsweise die ihnen zugrunde liegenden Benzoesäuren sind grundsätzlich bekannt und können beispielsweise gemäß den in WO 2012/126932 A1, US 6,376,429 B1, EP 1 585 742 A1 und EP 1 202 978 A1 beschriebenen Methoden hergestellt werden.

Erfindungsgemäße Verbindungen können auch nach der in Schema 2 angegebenen Methode durch Umsetzung einer Benzoe- bzw. Nicotinsäure der Formel (IV) mit einem 2-Amino-1,3,4-oxadiazol (III) hergestellt werden:



Für die Aktivierung können wasserentziehende Reagenzien, die üblicherweise für Amidierungsreaktionen, wie z. B. 1,1'-Carbonyldiimidazol (CDI), Dicyclohexyl-carbodiimid (DCC), 2,4,6-Tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatriphosphinane 2,4,6-trioxide (T3P) etc. eingesetzt werden.

- 5 Die 2-Amino-5-halogen-1,3,4-oxadiazole (III) sind bekannt und können gemäß dem Fachmann bekannten Methoden hergestellt werden.

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

Zur parallelisierten Reaktionsdurchführung und Aufarbeitung können eine Reihe von im Handel erhältlichen Geräten verwendet werden, beispielsweise Calypso-Reaktionsblöcke (Calypso reaction blocks) der Firma Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA oder Reaktionsstationen (reaction stations) der Firma Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, England oder MultiPROBE Automated Workstations der Firma Perkin Elmer, Waltham, Massachusetts 02451, USA. Für die parallelisierte Aufreinigung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Salzen beziehungsweise von bei der Herstellung anfallenden Zwischenprodukten stehen unter anderem Chromatographieapparaturen zur Verfügung, beispielsweise der Firma ISCO, Inc., 4700 Superior Street,
25 Lincoln, NE 68504, USA.

Die aufgeführten Apparaturen führen zu einer modularen Vorgehensweise, bei der die einzelnen Arbeitsschritte automatisiert sind, zwischen den Arbeitsschritten jedoch manuelle Operationen durchgeführt werden müssen. Dies kann durch den Einsatz von teilweise oder vollständig integrierten Automationssystemen umgangen werden, bei denen die jeweiligen Automationsmodule beispielsweise durch Roboter bedient werden. Derartige Automationssysteme können zum Beispiel von der Firma Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA bezogen werden.
30

Die Durchführung einzelner oder mehrerer Syntheseschritte kann durch den Einsatz von Polymer-supported reagents/Scavenger-Harze unterstützt werden. In der Fachliteratur sind eine Reihe von Versuchsprotokollen beschrieben, beispielsweise in ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).
35

Neben den hier beschriebenen Methoden kann die Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Salzen vollständig oder partiell durch Festphasen unterstützte Methoden erfolgen. Zu diesem Zweck werden einzelne Zwischenstufen oder alle Zwischenstufen der Synthese oder einer für die entsprechende Vorgehensweise angepassten Synthese an ein Synthescharz gebunden. Festphasenunterstützte Synthesemethoden sind in der Fachliteratur hinreichend beschrieben, z.B. Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998 und Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley, 1999. Die Verwendung von Festphasenunterstützten Synthesemethoden erlaubt eine Reihe von literaturbekannten Protokollen, die wiederum manuell oder automatisiert ausgeführt werden können. Die Reaktionen können beispielsweise mittels IRORI-Technologie in Mikroreaktoren (microreactors) der Firma Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA durchgeführt werden.

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

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

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) (und/oder deren Salze), im folgenden zusammen als „erfindungsgemäße Verbindungen“ bezeichnet, weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyle annueller Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Schadpflanzen, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist daher auch ein Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, vorzugsweise in Pflanzenkulturen, worin eine oder mehrere erfindungsgemäße Verbindung(en) auf die Pflanzen (z.B. Schadpflanzen wie mono- oder dikotyle Unkräuter oder unerwünschte Kulturpflanzen), das Saatgut (z.B. Körner, Samen oder vegetative Vermehrungsorgane wie Knollen oder Sprosssteile mit Knospen) oder die Fläche, auf der die Pflanzen wachsen (z.B. die Anbaufläche), ausgebracht werden. Dabei können die erfindungsgemäßen Verbindungen z.B. im Vorsaat- (ggf. auch durch Einarbeitung in den Boden), Vorauflauf- oder Nachauflaufverfahren ausgebracht werden. Im einzelnen seien beispielhaft

einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne dass durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

5 Monokotyle Schadpflanzen der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

10

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo,

15 Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so
20 wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt nach der
25 Behandlung Wachstumsstop ein und die Schadpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit ganz ab, so dass auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig beseitigt wird.

30 Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen z.B. dikotyler Kulturen der Gattungen Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia, oder monokotyler Kulturen der Gattungen Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza,
35 Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea, insbesondere Zea und Triticum, abhängig von der Struktur der jeweiligen erfindungsgemäßen Verbindung und deren Aufwandmenge nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen

Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in Pflanzenkulturen wie landwirtschaftlichen Nutzpflanzen oder Zierpflanzen.

5 Darüberhinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen (abhängig von ihrer jeweiligen Struktur und der ausgebrachten Aufwandmenge) hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Desweiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die
10 Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da beispielsweise die Lagerbildung hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Aufgrund ihrer herbiziden und pflanzenwachstumsregulatorischen Eigenschaften können die Wirkstoffe
15 auch zur Bekämpfung von Schädlingen in Kulturen von gentechnisch oder durch konventionelle Mutagenese veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch Resistenzen gegenüber bestimmten Pestiziden, vor allem bestimmten Herbiziden, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen wie Pilzen,
20 Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z. B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt.

25 Bevorzugt bezüglich transgener Kulturen ist die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen, z. B. von Getreide wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis und Mais oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten. Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen als Herbizide in Nutzpflanzenkulturen eingesetzt werden, welche
30 gegenüber den phytotoxischen Wirkungen der Herbizide resistent sind bzw. gentechnisch resistent gemacht worden sind.

Bevorzugt ist die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen oder deren Salze in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen, z. B. von Getreide wie Weizen, Gerste,
35 Roggen, Hafer, Hirse, Reis, Maniok und Mais oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten. Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen als Herbizide in Nutzpflanzenkulturen eingesetzt werden, welche

gegenüber den phytotoxischen Wirkungen der Herbizide resistent sind bzw. gentechnisch resistent gemacht worden sind.

- Herkömmliche Wege zur Herstellung neuer Pflanzen, die im Vergleich zu bisher vorkommenden Pflanzen modifizierte Eigenschaften aufweisen, bestehen beispielsweise in klassischen Züchtungsverfahren und der Erzeugung von Mutanten. Alternativ können neue Pflanzen mit veränderten Eigenschaften mit Hilfe gentechnischer Verfahren erzeugt werden (siehe z. B. EP-A-0221044, EP-A-0131624). Beschrieben wurden beispielsweise in mehreren Fällen
- gentechnische Veränderungen von Kulturpflanzen zwecks Modifikation der in den Pflanzen synthetisierten Stärke (z. B. WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),
 - transgene Kulturpflanzen, welche gegen bestimmte Herbizide vom Typ Glufosinate (vgl. z. B. EP-A-0242236, EP-A-242246) oder Glyphosate (WO 92/00377) oder der Sulfonylharnstoffe (EP-A-0257993, US-A-5013659) resistent sind,
 - transgene Kulturpflanzen, beispielsweise Baumwolle, mit der Fähigkeit *Bacillus thuringiensis*-Toxine (Bt-Toxine) zu produzieren, welche die Pflanzen gegen bestimmte Schädlinge resistent machen (EP-A-0142924, EP-A-0193259).
 - transgene Kulturpflanzen mit modifizierter Fettsäurezusammensetzung (WO 91/13972).
 - gentechnisch veränderte Kulturpflanzen mit neuen Inhalts- oder Sekundärstoffen z. B. neuen Phytoalexinen, die eine erhöhte Krankheitsresistenz verursachen (EPA 309862, EPA0464461)
 - gentechnisch veränderte Pflanzen mit reduzierter Photorespiration, die höhere Erträge und höhere Stresstoleranz aufweisen (EPA 0305398).
 - Transgene Kulturpflanzen, die pharmazeutisch oder diagnostisch wichtige Proteine produzieren („molecular pharming“)
 - transgene Kulturpflanzen, die sich durch höhere Erträge oder bessere Qualität auszeichnen
 - transgene Kulturpflanzen die sich durch eine Kombinationen z. B. der o. g. neuen Eigenschaften auszeichnen („gene stacking“)
- Zahlreiche molekularbiologische Techniken, mit denen neue transgene Pflanzen mit veränderten Eigenschaften hergestellt werden können, sind im Prinzip bekannt, siehe z. B. I. Potrykus und G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg. oder Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).
- Für derartige gentechnische Manipulationen können Nucleinsäuremoleküle in Plasmide eingebracht werden, die eine Mutagenese oder eine Sequenzveränderung durch Rekombination von DNA-Sequenzen erlauben. Mit Hilfe von Standardverfahren können z. B. Basenaustausche vorgenommen,

Teilsequenzen entfernt oder natürliche oder synthetische Sequenzen hinzugefügt werden. Für die Verbindung der DNA-Fragmente untereinander können an die Fragmente Adaptoren oder Linker angesetzt werden, siehe z. B. Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2. Aufl. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY, oder Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2. Auflage 1996

Die Herstellung von Pflanzenzellen mit einer verringerten Aktivität eines Genprodukts kann beispielsweise erzielt werden durch die Expression mindestens einer entsprechenden antisense-RNA, einer sense-RNA zur Erzielung eines Cosuppressionseffektes oder die Expression mindestens eines entsprechend konstruierten Ribozyms, das spezifisch Transkripte des obengenannten Genprodukts spaltet. Hierzu können zum einen DNA-Moleküle verwendet werden, die die gesamte codierende Sequenz eines Genprodukts einschließlich eventuell vorhandener flankierender Sequenzen umfassen, als auch DNA-Moleküle, die nur Teile der codierenden Sequenz umfassen, wobei diese Teile lang genug sein müssen, um in den Zellen einen antisense-Effekt zu bewirken. Möglich ist auch die Verwendung von DNA-Sequenzen, die einen hohen Grad an Homologie zu den codierten Sequenzen eines Genprodukts aufweisen, aber nicht vollkommen identisch sind.

Bei der Expression von Nucleinsäuremolekülen in Pflanzen kann das synthetisierte Protein in jedem beliebigen Kompartiment der pflanzlichen Zelle lokalisiert sein. Um aber die Lokalisation in einem bestimmten Kompartiment zu erreichen, kann z. B. die codierende Region mit DNA-Sequenzen verknüpft werden, die die Lokalisierung in einem bestimmten Kompartiment gewährleisten. Derartige Sequenzen sind dem Fachmann bekannt (siehe beispielsweise Braun et al., *EMBO J.* 11 (1992), 3219-3227, Wolter et al., *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* 85 (1988), 846-850, Sonnwald et al., *Plant J.* 1 (1991), 95-106). Die Expression der Nucleinsäuremoleküle kann auch in den Organellen der Pflanzenzellen stattfinden.

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

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

Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen in transgenen Kulturen eingesetzt werden, welche gegen Wachstumsstoffe, wie z. B. Dicamba oder gegen Herbizide, die essentielle Pflanzenenzyme, z. B. Acetolactatsynthasen (ALS), EPSP Synthasen, Glutaminsynthasen (GS) oder Hydroxyphenylpyruvat

Dioxygenasen (HPPD) hemmen, respektive gegen Herbizide aus der Gruppe der Sulfonylharnstoffe, der Glyphosate, Glufosinate oder Benzoylisoxazole und analogen Wirkstoffe, resistent sind.

Bei der Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe in transgenen Kulturen treten neben den in
5 anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schadpflanzen oftmals Wirkungen auf, die
für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, beispielsweise ein verändertes
oder speziell erweitertes Unkrautspektrum, das bekämpft werden kann, veränderte Aufwandmengen, die
für die Applikation eingesetzt werden können, vorzugsweise gute Kombinierbarkeit mit den Herbiziden,
gegenüber denen die transgene Kultur resistent ist, sowie Beeinflussung von Wuchs und Ertrag der
10 transgenen Kulturpflanzen.

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen als
Herbizide zur Bekämpfung von Schadpflanzen in transgenen Kulturpflanzen.

15 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in Form von Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten,
versprühbaren Lösungen, Stäubemitteln oder Granulaten in den üblichen Zubereitungen angewendet
werden. Gegenstand der Erfindung sind deshalb auch herbizide und pflanzenwachstumsregulierende
Mittel, welche die erfindungsgemäßen Verbindungen enthalten.

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

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

35 Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere
Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of
Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen,

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

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

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

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

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, oder Diatomeenerde. Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch
35 Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden. Emulsionen, z.B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rührern, Kolloidmühlen

und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wäßrigen organischen Lösungsmitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen. Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebmitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden. Wasserdispergierbare Granulate werden in der Regel nach den üblichen Verfahren wie Sprühtrocknung, Wirbelbett-Granulierung, Teller-Granulierung, Mischung mit Hochgeschwindigkeitsmischern und Extrusion ohne festes Inertmaterial hergestellt. Zur Herstellung von Teller-, Fließbett-, Extruder- und Sprühgranulate siehe z.B. Verfahren in "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, Seiten 147 ff, "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, S. 8-57. Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z.B. G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Seiten 81-96 und J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, Seiten 101-103.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0.1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0.1 bis 95 Gew.-%, erfindungsgemäße Verbindungen.

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten

1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0.05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-% Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden. Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

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

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

- 5 Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Verbindungen in Mischungs-formulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe, die auf einer Inhibition von beispielsweise Acetolactat-Synthase, Acetyl-CoA-Carboxylase, Cellulose-Synthase, Enolpyruvylshikimat-3-phosphat-Synthase, Glutamin-Synthetase, p-Hydroxyphenylpyruvat-Dioxygenase, Phytoendesaturase, Photo-system I, Photosystem II, Protoporphyrinogen-Oxidase beruhen, einsetzbar, wie sie z.B. aus Weed
10 Research 26 (1986) 441-445 oder "The Pesticide Manual", 15th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2009 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Als bekannte Herbizide oder Pflanzen-wachstumsregulatoren, die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, sind z.B. folgende Wirkstoffe zu nennen (die Verbindungen sind entweder mit dem "common name" nach der International Organization for Standardization (ISO)
15 oder mit dem chemischen Namen oder mit der Codenummer bezeichnet) und umfassen stets sämtliche Anwendungsformen wie Säuren, Salze, Ester und Isomere wie Stereoisomere und optische Isomere.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und
20 wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a.
25 variiert die erforderliche Aufwandmenge der Verbindungen der Formel (I). Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,001 und 1,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,005 und 750 g/ha.

Die nachstehenden Beispiele erläutern die Erfindung.

30

A. Chemische Beispiele

1. Herstellung von N-(5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-2-methyl-3-(methylsulfanyl)-4-(trifluormethyl)benzamid (Beisp. Nr. 1-143)

Zu einer Lösung von 700 mg (2,80 mmol) 2-Methyl-3-(methylsulfanyl)-4-(trifluormethyl)benzoesäure
35 und 435 mg (3,64 mmol) 2-Amino-5-chlor-1,3,4-oxadiazol in 20 ml Pyridin werden bei 0 °C 0,342 ml (3,92 mmol) Oxalylechlorid zugetropft. Nach 30 min. Rühren bei 0°C wird das Reaktionsgemisch weitere 14 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend werden 40 ml Dichlormethan und 20 ml Wasser

zugegeben. Die organische Phase wird abgetrennt und dann zweimal mit Wasser gewaschen, über Na_2SO_4 getrocknet und eingedampft. Der Rückstand wird säulenchromatographisch (prep. HPLC; Acetonitril / Wasser) gereinigt. Ausbeute 642 mg (62%).

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz; DMSO-d_6 : 7,72 ppm (d, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,58 (d, 1H), 2,81 (s, 3H), 2,32 (s, 3H).

5

2. Herstellung von N-(5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-2-methyl-3-(methylsulfinyl)-4-(trifluormethyl)benzamid (Beisp.-Nr. 1-144)

Eine Lösung von 220 mg (0,63 mmol) N-(5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-2-methyl-3-(methylsulfonyl)-4-(trifluormethyl)benzamid (Beisp. Nr. 1-143) in 20 ml Dichlormethan wird bei Raumtemperatur mit 144 mg (0,63 mmol) meta-Chlorperbenzoesäure versetzt. Nach 8 h Rühren bei Raumtemperatur, werden 5 ml einer wäßrigen Natriumbisulfit-Lösung zugegeben. Die organische Phase wird abgetrennt und dann zweimal mit Wasser gewaschen, über Na_2SO_4 getrocknet und eingedampft. Der Rückstand wird säulenchromatographisch (prep. HPLC; Acetonitril / Wasser) gereinigt. Ausbeute 149 mg (61%).

10 gereinigt. Ausbeute 642 mg (62%).

15 $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz; DMSO-d_6 : 11,82 ppm (bs, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 3,05 (s, 3H), 2,87 (s, 3H).

3. Herstellung von N-(5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-2-methyl-3-(methylsulfonyl)-4-(trifluormethyl)benzamid (Beisp.-Nr. 1-145)

20

Eine Lösung von 220 mg (0,63 mmol) N-(5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl)-2-methyl-3-(methylsulfonyl)-4-(trifluormethyl)benzamid (Beisp. Nr. 1-143) in 20 ml Dichlormethan wird bei Raumtemperatur mit 331 mg (1,44 mmol) meta-Chlorperbenzoesäure versetzt. Nach 30 h Rühren bei Raumtemperatur, werden 15 ml einer wäßrigen Natriumbisulfit-Lösung zugegeben. Die ausgefallenen Kristalle werden abfiltriert und getrocknet.

25

Ausbeute 186 mg (61%).

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz; DMSO-d_6 : 8,02 ppm (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,74 (s, 3H).

Die verwendeten Abkürzungen bedeuten:

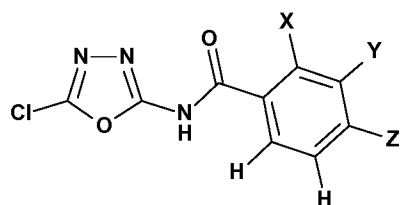
Et = Ethyl	Me = Methyl	n-Pr = n-Propyl	i-Pr = Isopropyl
c-Pr = Cyclopropyl	Ph = Phenyl	Ac = Acetyl	Bz = Benzoyl

30

Die in nachfolgenden Tabellen genannten Verbindungen wurden nach den oben genannten Methoden hergestellt beziehungsweise können analog 'dazu hergestellt werden.

Tabelle 1: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin A für CY, V und W für Wasserstoff und Hal für Chlor steht

5



Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-1	F	H	Cl	
1-2	F	H	SO ₂ Me	
1-3	F	H	SO ₂ Et	
1-4	F	H	CF ₃	
1-5	F	H	NO ₂	
1-6	Cl	H	Br	
1-7	Cl	H	SMe	
1-8	Cl	H	SOMe	
1-9	Cl	H	SO ₂ Me	
1-10	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl	
1-11	Cl	H	SEt	
1-12	Cl	H	SO ₂ Et	
1-13	Cl	H	CF ₃	
1-14	Cl	H	NO ₂	
1-15	Cl	H	pyrazol-1-yl	
1-16	Cl	H	1H-1,2,4-triazol-1-yl	
1-17	Br	H	Cl	
1-18	Br	H	Br	
1-19	Br	H	SO ₂ Me	
1-20	Br	H	SO ₂ Et	
1-21	Br	H	CF ₃	
1-22	SO ₂ Me	H	Cl	
1-23	SO ₂ Me	H	Br	
1-24	SO ₂ Me	H	SMe	
1-25	SO ₂ Me	H	SOMe	
1-26	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me	
1-27	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-28	SO ₂ Me	H	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 12,048 (1,9); 8,333 (1,8); 8,313 (2,2); 8,296 (5,6); 8,295 (5,4); 8,292 (4,2); 8,076 (2,5); 8,056 (2,1); 3,434 (33,4); 3,324 (105,2); 3,274 (1,0); 2,524 (1,0); 2,519 (1,4); 2,510 (18,2); 2,506 (39,9); 2,501 (56,1); 2,497 (38,9); 2,492 (16,9); 2,451 (0,5); 2,073 (16,0)
1-29	SO ₂ Et	H	Cl	
1-30	SO ₂ Et	H	Br	
1-31	SO ₂ Et	H	SMe	
1-32	SO ₂ Et	H	SOMe	
1-33	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me	
1-34	SO ₂ Et	H	CF ₃	
1-35	NO ₂	H	F	
1-36	NO ₂	H	Cl	
1-37	NO ₂	H	Br	
1-38	NO ₂	H	I	
1-39	NO ₂	H	CN	
1-40	NO ₂	H	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,268 (0,5); 7,2674 (0,6); 7,2666 (0,7); 7,266 (0,8); 7,265 (1,0); 7,264 (1,2); 7,263 (1,6); 7,260 (67,5); 7,257 (1,0); 7,256 (0,6); 1,534 (16,0); 0,008 (0,9); 0,000 (30,3); -0,009 (0,8)
1-41	NO ₂	H	SO ₂ Et	
1-42	NO ₂	H	CF ₃	
1-43	Me	H	Cl	
1-44	Me	H	Br	
1-45	Me	H	SMe	
1-46	Me	H	SO ₂ Me	
1-47	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl	
1-48	Me	H	SEt	
1-49	Me	H	SO ₂ Et	
1-50	Me	H	CF ₃	
1-51	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	
1-52	Et	H	Cl	
1-53	Et	H	Br	
1-54	Et	H	SMe	
1-55	Et	H	SO ₂ Me	
1-56	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl	
1-57	Et	H	SEt	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-58	Et	H	SO ₂ Et	
1-59	Et	H	CF ₃	
1-60	CF ₃	H	Cl	
1-61	CF ₃	H	Br	
1-62	CF ₃	H	SO ₂ Me	
1-63	CF ₃	H	SO ₂ Et	
1-64	CF ₃	H	CF ₃	
1-65	NO ₂	NH ₂	F	
1-66	NO ₂	NHMe	F	
1-67	NO ₂	NMe ₂	F	
1-68	NO ₂	Me	Cl	
1-69	NO ₂	NH ₂	Cl	
1-70	NO ₂	NHMe	Cl	
1-71	NO ₂	NMe ₂	Cl	
1-72	NO ₂	NH ₂	Br	
1-73	NO ₂	NHMe	Br	
1-74	NO ₂	NMe ₂	Br	
1-75	NO ₂	NH ₂	CF ₃	
1-76	NO ₂	NMe ₂	CF ₃	
1-77	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me	
1-78	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et	
1-79	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me	
1-80	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me	
1-81	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et	
1-82	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-triazol-1-yl	
1-83	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-triazol-1-yl	
1-84	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-triazol-1-yl	
1-85	Me	SMe	H	
1-86	Me	SOMe	H	
1-87	Me	SO ₂ Me	H	
1-88	Me	SEt	H	
1-89	Me	SOEt	H	
1-90	Me	SO ₂ Et	H	
1-91	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H	
1-92	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H	
1-93	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H	
1-94	Me	F	F	
1-95	Me	F	Cl	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-96	Me	SEt	F	
1-97	Me	SOEt	F	
1-98	Me	SO ₂ Et	F	
1-99	Me	Me	Cl	
1-100	Me	F	Cl	
1-101	Me	Cl	Cl	
1-102	Me	NH ₂	Cl	
1-103	Me	NHMe	Cl	
1-104	Me	NMe ₂	Cl	
1-105	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-106	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl	
1-107	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl	
1-108	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl	
1-109	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl	
1-110	Me	O(CH ₂) ₂ - NH(CO)NMe ₂	Cl	
1-111	Me	O(CH ₂) ₂ - NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl	
1-112	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl	
1-113	Me	OCH ₂ -NHCO ₂ cPr	Cl	
1-114	Me	O(CH ₂)-5-2,4- dimethyl-2,4-dihydro- 3H-1,2,4-triazol-3-on	Cl	
1-115	Me	O(CH ₂)-3,5-dime- thyl-1,2-oxazol-4-yl	Cl	
1-116	Me	SMe	Cl	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,451 (0,5); 7,430 (1,8); 7,413 (2,1); 7,393 (0,6); 7,262 (11,0); 2,746 (7,9); 2,374 (16,0); 0,000 (4,7)
1-117	Me	SOMe	Cl	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,561 (0,9); 7,541 (1,1); 7,388 (1,0); 7,366 (0,8); 7,310 (0,8); 7,260 (53,1); 7,210 (2,0); 3,150 (0,7); 2,932 (8,5); 2,697 (5,3); 1,540 (16,0); 1,490 (0,7); 0,008 (0,8); 0,000 (22,3); -0,009 (1,2); -0,050 (0,9)
1-118	Me	SO ₂ Me	Cl	
1-119	Me	SEt	Cl	
1-120	Me	SOEt	Cl	
1-121	Me	SO ₂ Et	Cl	
1-122	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-123	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-124	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-125	Me	NH ₂	Br	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-126	Me	NHMe	Br	
1-127	Me	NMe ₂	Br	
1-128	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Br	
1-129	Me	O(CH ₂)-5-pyrrolidin- 2-on	Br	
1-130	Me	SMe	Br	
1-131	Me	SOMe	Br	
1-132	Me	SO ₂ Me	Br	
1-133	Me	SEt	Br	
1-134	Me	SOEt	Br	
1-135	Me	SO ₂ Et	Br	
1-136	Me	SMe	I	
1-137	Me	SOMe	I	
1-138	Me	SO ₂ Me	I	
1-139	Me	SEt	I	
1-140	Me	SOEt	I	
1-141	Me	SO ₂ Et	I	
1-142	Me	Cl	CF ₃	
1-143	Me	SMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,729 (1,3); 7,709 (1,8); 7,598 (1,7); 7,578 (1,0); 7,518 (1,2); 7,260 (222,5); 6,996 (1,2); 2,807 (11,7); 2,321 (16,0); 1,534 (6,6); 0,008 (2,5); 0,000 (86,9); - 0,009 (2,4)
1-144	Me	SOMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 7,889 (1,0); 7,869 (3,7); 7,856 (3,1); 7,835 (0,8); 3,312 (13,6); 3,055 (16,0); 2,870 (14,9); 2,523 (1,0); 2,518 (1,5); 2,510 (16,5); 2,505 (34,6); 2,501 (47,5); 2,496 (33,2); 2,491 (14,8); 0,000 (0,6)
1-145	Me	SO ₂ Me	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,858 (0,9); 8,032 (1,5); 8,012 (2,6); 7,974 (2,4); 7,953 (1,2); 3,421 (18,0); 3,312 (572,1); 3,261 (4,7); 2,745 (16,0); 2,669 (3,6); 2,501 (460,6); 2,327 (3,4); 2,209 (0,9); 1,209 (0,6); 1,193 (0,6); 0,000 (1,0)
1-146	Me	SEt	CF ₃	
1-147	Me	SOEt	CF ₃	
1-148	Me	SO ₂ Et	CF ₃	
1-149	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-150	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-151	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-152	Me	Me	SO ₂ Me	
1-153	Me	4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,930 (1,0); 7,910 (1,2); 7,762 (1,9); 7,741 (1,5); 7,264 (21,1); 4,622 (1,6); 4,597 (3,7); 4,572 (1,8); 3,475 (2,0); 3,350 (0,9); 3,325 (1,7); 3,300 (0,8); 3,185 (16,0); 3,057 (0,7); 2,940 (4,1); 2,824 (3,2); 2,461 (10,3); 1,604 (0,5); 0,000 (9,3)
1-154	Me	4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Et	
1-155	Me	5-cyanomethyl- 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Me	
1-156	Me	5-cyanomethyl- 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Et	
1-157	Me	NH ₂	SO ₂ Me	
1-158	Me	NHMe	SO ₂ Me	
1-159	Me	NMe ₂	SO ₂ Me	
1-160	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-161	Me	pyrazol-1-yl	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 9,070 (0,5); 7,930 (1,4); 7,910 (1,6); 7,815 (2,3); 7,802 (2,3); 7,801 (2,5); 7,797 (2,6); 7,796 (2,8); 7,706 (2,3); 7,705 (2,4); 7,700 (2,5); 7,698 (2,2); 7,264 (18,9); 6,571 (2,2); 6,566 (2,4); 6,565 (2,4); 6,560 (2,1); 3,475 (1,0); 2,972 (16,0); 2,953 (5,0); 2,952 (5,1); 2,849 (4,2); 2,847 (4,0); 2,050 (11,0); 0,000 (8,4)
1-162	Me	OH	SO ₂ Me	
1-163	Me	OMe	SO ₂ Me	
1-164	Me	OMe	SO ₂ Et	
1-165	Me	OEt	SO ₂ Me	
1-166	Me	OEt	SO ₂ Et	
1-167	Me	OiPr	SO ₂ Me	
1-168	Me	OiPr	SO ₂ Et	
1-169	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-170	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-171	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-172	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-173	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-174	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-175	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-176	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et	
1-177	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me	
1-178	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et	
1-179	Me	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	SO ₂ Me	
1-180	Me	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	SO ₂ Et	
1-181	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-dimethoxypyrimidin-2-yl)	SO ₂ Me	
1-182	Me	Cl	SO ₂ Me	
1-183	Me	SMe	SO ₂ Me	
1-184	Me	SOMe	SO ₂ Me	
1-185	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,369 (0,5); 8,348 (0,6); 7,519 (0,9); 7,260 (154,8); 7,210 (1,1); 6,996 (0,9); 3,579 (6,2); 3,488 (5,7); 2,867 (2,6); 1,537 (16,0); 0,008 (2,1); 0,000 (63,4); -0,009 (1,9); -0,050 (0,6)
1-186	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et	
1-187	Me	SEt	SO ₂ Me	
1-188	Me	SOEt	SO ₂ Me	
1-189	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me	
1-190	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-191	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-192	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-193	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me	
1-194	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me	
1-195	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me	
1-196	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me	
1-197	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me	
1-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-200	Et	SMe	Cl	
1-201	Et	SO ₂ Me	Cl	
1-202	Et	SMe	CF ₃	
1-203	Et	SO ₂ Me	CF ₃	
1-204	Et	F	SO ₂ Me	
1-205	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-206	iPr	SO ₂ Me	CF ₃	
1-207	cPr	SO ₂ Me	CF ₃	
1-208	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-209	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F	
1-210	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F	
1-211	CF ₃	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	F	
1-212	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-213	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl	
1-214	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl	
1-215	CF ₃	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	Cl	
1-216	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	
1-217	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br	
1-218	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br	
1-219	CF ₃	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	Br	
1-220	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I	
1-221	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I	
1-222	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I	
1-223	CF ₃	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	I	
1-224	CF ₃	F	SO ₂ Me	
1-225	CF ₃	F	SO ₂ Et	
1-226	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-227	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-228	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-229	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-230	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me	
1-231	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et	
1-232	CF ₃	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	SO ₂ Me	
1-233	CF ₃	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	SO ₂ Et	
1-234	F	SMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,282 (0,8); 8,280 (0,8); 8,261 (1,5); 8,243 (0,9); 7,739 (2,2); 7,719 (2,0); 7,267 (0,5); 7,266 (0,6); 7,2653 (0,8); 7,2645 (1,1); 7,261 (49,0); 7,258 (0,7); 2,523 (16,0); 1,546 (5,9); 0,008 (0,6); 0,000 (21,3); -0,009 (0,6)
1-235	F	SOMe	CF ₃	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-236	F	SO ₂ Me	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,988 (1,8); 8,272 (1,3); 8,253 (2,0); 8,235 (1,6); 8,057 (3,3); 8,036 (2,7); 3,514 (16,0); 3,510 (15,9); 3,311 (20,9); 2,551 (0,7); 2,523 (1,1); 2,518 (1,6); 2,510 (24,0); 2,505 (52,2); 2,501 (72,8); 2,496 (51,8); 2,491 (24,3); 2,456 (1,3); 2,451 (1,5); 2,446 (1,2); 2,327 (0,6); 2,073 (3,7); 0,008 (0,6); 0,000 (18,6); -0,009 (0,7)
1-237	Cl	Me	Cl	
1-238	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl	
1-239	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-240	Cl	OCH ₂ CONMe ₂	Cl	
1-241	Cl	O(CH ₂)-5-pyrrolidin- 2-on	Cl	
1-242	Cl	SMe	Cl	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,683 (0,6); 7,564 (3,1); 7,543 (2,4); 7,262 (10,7); 2,474 (16,0); 0,000 (4,7)
1-243	Cl	SOMe	Cl	
1-244	Cl	SO ₂ Me	Cl	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,749 (0,6); 7,728 (0,9); 7,662 (3,4); 7,641 (2,2); 7,310 (1,1); 7,260 (63,7); 7,210 (2,6); 3,347 (16,0); 3,297 (0,7); 1,549 (11,3); 1,499 (0,6); 0,008 (1,0); 0,000 (26,6); -0,008 (1,4); -0,050 (1,0)
1-245	Cl	F	SMe	
1-246	Cl	Cl	SO ₂ Me	
1-247	Cl	COOMe	SO ₂ Me	
1-248	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me	
1-249	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me	
1-250	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,999 (0,9); 7,978 (1,1); 7,749 (1,2); 7,728 (1,0); 7,263 (17,4); 5,023 (5,5); 3,511 (16,0); 3,224 (14,4); 2,932 (3,4); 2,819 (2,8); 2,818 (2,5); 1,589 (1,0); 0,000 (7,4)
1-251	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-252	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me	
1-253	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et	
1-254	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-255	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,023 (1,1); 8,003 (1,3); 7,869 (0,5); 7,789 (1,3); 7,768 (1,1); 7,266 (0,6); 7,263 (19,1); 5,290 (5,5); 4,074 (1,1); 4,053 (3,5); 4,031 (3,6); 4,010 (1,2); 3,473 (0,9); 3,200 (16,0); 2,926 (4,1); 2,925 (4,3); 2,804 (3,8); 2,802 (3,8); 0,000 (8,4)
1-256	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et	
1-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me	
1-258	Cl	CH ₂ OcPentyl	SO ₂ Me	
1-259	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me	
1-260	Cl	4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SMe	
1-261	Cl	4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Me	
1-262	Cl	4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Et	
1-263	Cl	5-cyanomethyl- 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Me	
1-264	Cl	5-cyanomethyl- 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Et	
1-265	Cl	5-(Methoxyme-thyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Et	
1-266	Cl	5-(Methoxyme-thyl)-5-Methyl- 4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl	SO ₂ Et	
1-267	Cl	CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl	SO ₂ Me	
1-268	Cl	CH ₂ O-tetrahydrofuran-3-yl	SO ₂ Et	
1-269	Cl	CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl	SO ₂ Me	
1-270	Cl	CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-2-yl	SO ₂ Et	
1-271	Cl	CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl	SO ₂ Me	
1-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -tetrahydrofuran-3-yl	SO ₂ Et	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-273	Cl	OMe	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,975 (2,5); 7,955 (2,9); 7,2654 (0,5); 7,2646 (0,7); 7,264 (1,1); 7,261 (33,8); 7,258 (0,6); 4,109 (15,3); 3,266 (16,0); 1,552 (3,0); 0,000 (15,4)
1-274	Cl	OMe	SO ₂ Et	
1-275	Cl	OEt	SO ₂ Me	
1-276	Cl	OEt	SO ₂ Et	
1-277	Cl	OiPr	SO ₂ Me	
1-278	Cl	OiPr	SO ₂ Et	
1-279	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-280	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-281	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-282	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-283	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-284	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-285	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-286	Cl	[1,4]dioxan-2-yl- methoxy	SO ₂ Me	
1-287	Cl	[1,4]dioxan-2-yl- methoxy	SO ₂ Et	
1-288	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me	
1-289	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et	
1-290	Cl	SMe	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,225 (2,4); 8,205 (2,5); 7,519 (0,9); 7,2733 (0,5); 7,2726 (0,6); 7,272 (0,7); 7,271 (0,7); 7,270 (0,9); 7,2693 (1,1); 7,2686 (1,2); 7,268 (1,5); 7,267 (1,7); 7,266 (1,9); 7,2653 (2,3); 7,2645 (3,0); 7,264 (4,1); 7,260 (167,9); 7,2563 (1,3); 7,2555 (1,0); 7,255 (0,8); 7,254 (0,6); 7,211 (1,1); 6,996 (1,0); 3,477 (16,0); 3,286 (0,5); 3,006 (0,5); 2,544 (10,9); 1,539 (14,4); 0,008 (2,1); 0,006 (0,6); 0,005 (0,7); 0,000 (73,2); -0,009 (2,0)
1-291	Cl	SO ₂ Me	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,452 (0,6); 8,432 (0,6); 7,519 (0,6); 7,309 (1,3); 7,260 (109,0); 7,209 (3,1); 6,996 (0,6); 3,623 (3,6); 3,524 (2,6); 1,538 (16,0); 1,488 (0,7); 0,049 (0,5); 0,008 (2,2); 0,000 (45,2); -0,008 (2,4); - 0,051 (1,4)
1-292	Br	OMe	Br	
1-293	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-294	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-295	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-296	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-297	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-298	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-299	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-300	Br	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	SO ₂ Me	
1-301	Br	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	SO ₂ Et	
1-302	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-303	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et	
1-304	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	
1-305	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et	
1-306	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me	
1-307	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et	
1-308	I	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	SO ₂ Me	
1-309	I	[1,4]dioxan-2-yl-methoxy	SO ₂ Et	
1-310	OMe	SMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ =8,330 (1,0); 8,309 (1,0); 7,707 (1,7); 7,686 (1,6); 7,261 (25,9); 4,200 (16,0); 2,501 (11,9); 1,543 (1,5); 0,000 (11,0)
1-311	OMe	SOMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ =9,829 (0,6); 8,427 (1,0); 8,405 (1,2); 7,777 (2,3); 7,756 (2,2); 7,519 (0,9); 7,309 (1,7); 7,260 (167,0); 7,219 (1,9); 7,210 (5,5); 6,996 (0,9); 4,237 (16,0); 4,187 (0,6); 3,154 (12,5); 3,104 (0,6); 1,544 (6,2); 0,049 (0,5); 0,008 (3,1); 0,000 (69,3); -0,008 (4,0); -0,042 (0,9); -0,051 (2,4)
1-312	OMe	SO ₂ Me	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ =8,439 (0,8); 8,419 (0,9); 7,938 (2,6); 7,917 (2,4); 7,263 (21,1); 4,185 (16,0); 3,487 (4,7); 3,404 (11,1); 3,194 (1,2); 2,952 (0,9); 2,860 (0,8); 1,579 (0,8); 0,000 (8,7)
1-313	OMe	SOEt	CF ₃	
1-314	OMe	SO ₂ Et	CF ₃	
1-315	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-316	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-317	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-318	OMe	SMe	Cl	
1-319	OMe	SOMe	Cl	
1-320	OMe	SO ₂ Me	Cl	
1-321	OMe	SEt	Cl	
1-322	OMe	SOEt	Cl	
1-323	OMe	SO ₂ Et	Cl	
1-324	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-325	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-326	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-327	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃	
1-328	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃	
1-329	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃	
1-330	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃	
1-331	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃	
1-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃	
1-333	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-334	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	
1-336	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl	
1-337	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl	
1-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl	
1-339	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl	
1-340	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl	
1-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl	
1-342	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-343	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl	
1-345	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me	
1-346	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me	
1-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-348	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me	
1-349	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me	
1-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me	
1-351	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-352	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me	
1-354	SO ₂ Me	F	CF ₃	
1-355	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃	
1-356	SO ₂ Me	NHEt	Cl	
1-357	SMe	SEt	F	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-358	SMe	SMe	F	
1-359	SMe	SMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,861 (1,8); 7,840 (1,5); 7,262 (20,0); 2,571 (16,0); 2,500 (12,2); 2,450 (1,1); 1,555 (0,7); 0,000 (8,7)
1-360	SMe	SOMe	CF ₃	
1-361	SMe	SO ₂ Me	CF ₃	
1-362	SMe	SMe	Cl	
1-363	SMe	SMe	Br	
1-364	Cl	Ac	CF ₃	
1-365	Cl	Ac	SO ₂ Me	
1-366	Cl	C(O)cPr	CF ₃	
1-367	Cl	C(O)cPr	SO ₂ Me	
1-368	Cl	CH ₂ SMe	CF ₃	
1-369	Cl	CH ₂ S(O)Me	CF ₃	
1-370	Cl	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	
1-371	Cl	CH ₂ SMe	SO ₂ Me	
1-372	Cl	CH ₂ S(O)Me	SO ₂ Me	
1-373	Cl	CH ₂ SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-374	Cl	CH=NOMe	CF ₃	
1-375	Cl	CH=NOMe	SO ₂ Me	
1-376	Cl	4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl	CF ₃	
1-377	Cl	4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl	SO ₂ Me	
1-378	Cl	3-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl	CF ₃	
1-379	Cl	3-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl	SO ₂ Me	
1-380	Cl	vinyl	CF ₃	
1-381	Cl	vinyl	SO ₂ Me	
1-382	Cl	CO ₂ Me	CF ₃	
1-383	Cl	CO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-384	Cl	SMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,814 (4,0); 7,2664 (0,6); 7,2656 (0,8); 7,265 (1,0); 7,264 (1,5); 7,261 (66,9); 7,257 (0,8); 7,256 (0,6); 2,453 (16,0); 1,547 (2,9); 0,008 (0,8); 0,002 (1,2); 0,000 (28,1); -0,004 (0,5); -0,009 (0,8)

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-385	Cl	S(O)Me	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,057 (1,1); 7,950 (0,7); 7,838 (2,1); 7,826 (4,0); 7,805 (1,1); 7,571 (0,8); 7,519 (2,1); 7,437 (0,7); 7,417 (1,0); 7,398 (0,6); 7,310 (4,6); 7,292 (0,9); 7,260 (395,5); 7,210 (12,7); 6,996 (2,4); 3,491 (1,4); 3,113 (16,0); 3,063 (0,8); 1,542 (7,8); 0,050 (1,8); 0,008 (5,3); 0,000 (163,4); -0,008 (7,9); -0,050 (5,3); -0,150 (0,7)
1-386	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,009 (0,6); 7,260 (38,7); 7,210 (1,0); 3,361 (3,7); 1,543 (16,0); 0,008 (0,7); 0,000 (16,4); -0,009 (0,8)
1-387	Cl	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-388	Cl	SMe	Me	
1-389	Cl	SOMe	Me	
1-390	Cl	SO ₂ Me	Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,614 (0,7); 7,593 (1,3); 7,543 (2,0); 7,522 (1,2); 7,310 (1,1); 7,260 (71,2); 7,210 (2,9); 3,395 (1,2); 3,392 (1,2); 3,282 (13,1); 3,232 (0,6); 2,811 (9,2); 1,544 (16,0); 1,494 (0,8); 0,008 (0,9); 0,000 (29,9); -0,008 (1,7); -0,050 (1,3)
1-391	Cl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	CF ₃	
1-392	Cl	1H-1,2,3-triazol-1-yl	CF ₃	
1-393	Cl	2H-1,2,3-triazol-2-yl	CF ₃	
1-394	Cl	1H-pyrazol-1-yl	CF ₃	
1-395	Cl	1H-4-Chlorpyrazol-1-yl	CF ₃	
1-396	Cl	1H-3-brom-pyrazol-1-yl	CF ₃	
1-397	Cl	1H-4-trifluormethyl-pyrazol-1-yl	CF ₃	
1-398	Cl	pyrolidin-2-on-1-yl	CF ₃	
1-399	Cl	morpholin-3-on-4-yl	CF ₃	
1-400	Cl	1,2-Thiazolidin-1,1-dioxid-2-yl	CF ₃	
1-401	Br	1H-1,2,4-triazol-1-yl	CF ₃	
1-402	Br	1H-1,2,3-triazol-1-yl	CF ₃	
1-403	Br	2H-1,2,3-triazol-2-yl	CF ₃	
1-404	Br	1H-pyrazol-1-yl	CF ₃	
1-405	Br	1H-4-Chlorpyrazol-1-yl	CF ₃	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-406	Br	1H-3-brom-pyrazol-1-yl	CF ₃	
1-407	Br	1H-4-trifluormethyl-pyrazol-1-yl	CF ₃	
1-408	Br	pyrrolidin-2-on-1-yl	CF ₃	
1-409	Br	morpholin-3-on-4-yl	CF ₃	
1-410	Br	1,2-Thiazolidin-1,1-dioxid-2-yl	CF ₃	
1-411	CH ₂ OMe	1H-1,2,4-triazol-1-yl	CF ₃	
1-412	CH ₂ OMe	1H-1,2,3-triazol-1-yl	CF ₃	
1-413	CH ₂ OMe	2H-1,2,3-triazol-2-yl	CF ₃	
1-414	CF ₃	OCH ₂ CH ₂ F	CF ₃	
1-415	CF ₃	OMe	CF ₃	
1-416	CF ₃	SMe	CF ₃	
1-417	CF ₃	SOMe	CF ₃	
1-418	CF ₃	SO ₂ Me	CF ₃	
1-419	CF ₃	1H-pyrazol-1-yl	CF ₃	
1-420	Me	SMe	Et	
1-421	Me	SOMe	Et	
1-422	Me	SO ₂ Me	Et	
1-423	Me	1H-pyrazol-1-yl	Et	
1-424	Me	OCH ₂ CH ₂ F	Et	
1-425	Me	OMe	Et	
1-426	Me	Ac	CF ₃	
1-427	Me	Ac	SO ₂ Me	
1-428	Me	C(O)cPr	CF ₃	
1-429	Me	C(O)cPr	SO ₂ Me	
1-430	Me	CH ₂ SMe	CF ₃	
1-431	Me	CH ₂ S(O)Me	CF ₃	
1-432	Me	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	
1-433	Me	CH ₂ SMe	SO ₂ Me	
1-434	Me	CH ₂ S(O)Me	SO ₂ Me	
1-435	Me	CH ₂ SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-436	Me	CH=NOMe	CF ₃	
1-437	Me	CH=NOMe	SO ₂ Me	
1-438	Me	4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl	CF ₃	
1-439	Me	4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl	SO ₂ Me	
1-440	Me	3-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl	CF ₃	

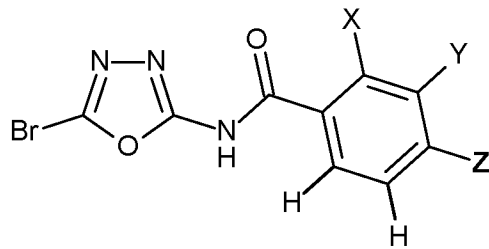
Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-441	Me	3-methyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl	SO ₂ Me	
1-442	Me	vinyl	CF ₃	
1-443	Me	vinyl	SO ₂ Me	
1-444	Me	CO ₂ Me	CF ₃	
1-445	Me	CO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-446	CF ₃	1H-pyrazol-1-yl	CF ₃	
1-447	CF ₃	1H-pyrazol-1-yl	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,465 (3,1); 8,445 (3,3); 7,935 (2,4); 7,817 (5,0); 7,816 (5,4); 7,812 (5,2); 7,811 (5,2); 7,794 (2,9); 7,788 (2,8); 7,520 (0,6); 7,272 (0,6); 7,271 (0,7); 7,2704 (0,8); 7,2695 (0,8); 7,269 (0,9); 7,268 (1,0); 7,267 (1,3); 7,2663 (1,6); 7,2655 (2,0); 7,261 (107,4); 7,2574 (1,1); 7,2565 (0,8); 7,256 (0,5); 7,211 (0,6); 6,997 (0,6); 6,576 (4,5); 6,571 (4,8); 6,570 (4,9); 6,565 (4,3); 3,005 (9,1); 2,9502 (15,5); 2,9495 (16,0); 2,837 (12,8); 2,835 (12,5); 1,589 (2,2); 0,008 (1,4); 0,000 (44,8); -0,009 (1,3)
1-448	CF ₃	1H-pyrazol-1-yl	SO ₂ Et	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,392 (2,1); 8,372 (2,3); 7,937 (2,6); 7,923 (0,8); 7,791 (8,5); 7,786 (8,4); 7,262 (79,8); 6,556 (3,7); 6,551 (4,5); 6,545 (3,7); 3,116 (0,6); 3,098 (1,5); 3,079 (1,6); 3,062 (0,6); 2,950 (16,0); 2,949 (16,0); 2,839 (13,4); 2,837 (13,5); 1,597 (1,1); 1,220 (6,7); 1,201 (15,2); 1,183 (6,5); 0,008 (0,9); 0,000 (34,7); -0,009 (1,0)
1-449	OEt	1H-pyrazol-1-yl	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 10,270 (0,9); 8,485 (1,6); 8,483 (1,6); 8,464 (1,7); 8,462 (1,7); 7,850 (3,0); 7,848 (3,1); 7,845 (3,1); 7,844 (2,9); 7,776 (2,8); 7,775 (2,7); 7,755 (2,6); 7,754 (2,6); 7,661 (2,4); 7,655 (2,4); 7,267 (0,5); 7,266 (0,7); 7,263 (28,3); 6,580 (3,2); 6,576 (3,4); 6,574 (3,4); 6,570 (3,0); 3,743 (2,1); 3,726 (7,1); 3,708 (7,1); 3,690 (2,2); 1,566 (1,3); 1,206 (7,3); 1,188 (16,0); 1,170 (7,1); 0,000 (12,0)
1-450	OMe	1H-pyrazol-1-yl	CF ₃	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-451	Cl	1H-pyrazol-1-yl	SO ₂ Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,133 (1,9); 8,113 (2,4); 7,977 (1,2); 7,956 (1,0); 7,833 (2,1); 7,830 (2,1); 7,829 (2,1); 7,754 (2,0); 7,748 (2,0); 7,263 (15,4); 6,591 (1,8); 6,586 (2,0); 6,585 (2,0); 6,580 (1,7); 3,474 (1,2); 3,076 (16,0); 2,953 (2,5); 2,840 (2,1); 2,838 (2,0); 1,635 (0,9); 0,000 (6,6)
1-452	Cl	SMe	c-Pr	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,750 (0,7); 7,729 (0,7); 7,265 (0,5); 7,264 (0,7); 7,261 (29,5); 6,886 (1,6); 6,865 (1,5); 2,841 (0,6); 2,417 (16,0); 1,543 (6,5); 1,193 (1,1); 1,189 (1,1); 1,184 (0,6); 1,177 (0,6); 1,172 (1,1); 1,168 (1,1); 1,156 (0,5); 0,809 (0,5); 0,797 (1,1); 0,793 (1,1); 0,784 (1,0); 0,780 (1,2); 0,000 (12,8)
1-453	Cl	SOMe	c-Pr	
1-454	Cl	SO ₂ Me	c-Pr	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,744 (0,6); 7,722 (0,7); 7,310 (1,1); 7,260 (78,7); 7,235 (1,9); 7,210 (2,8); 3,352 (11,4); 3,057 (0,6); 1,545 (16,0); 1,495 (0,8); 1,216 (1,1); 1,213 (1,2); 1,207 (0,7); 1,200 (0,6); 1,195 (1,2); 1,191 (1,2); 1,179 (0,6); 0,818 (1,2); 0,815 (1,3); 0,804 (1,3); 0,801 (1,3); 0,008 (1,1); 0,000 (32,5); -0,009 (1,6); -0,050 (1,2)
1-455	Cl	SMe	H	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,587 (0,7); 7,583 (0,7); 7,568 (0,9); 7,564 (0,9); 7,438 (1,7); 7,419 (3,0); 7,399 (2,3); 7,358 (1,5); 7,354 (1,5); 7,338 (0,9); 7,334 (0,8); 7,265 (0,6); 7,264 (0,8); 7,261 (33,9); 2,535 (16,0); 1,547 (2,4); 0,002 (0,6); 0,000 (13,9); -0,003 (0,5)
1-456	Cl	SOMe	H	
1-457	Cl	SO ₂ Me	H	
1-458	Cl	SEt	H	
1-459	Cl	SOEt	H	
1-460	Cl	SO ₂ Et	H	

Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-461	Cl	NH(CO)-pyrrolidin	Cl	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 9,387 (1,7); 7,595 (5,0); 7,574 (7,5); 7,520 (1,8); 7,494 (11,2); 7,473 (7,6); 7,279 (0,6); 7,278 (0,6); 7,277 (0,5); 7,276 (0,7); 7,2754 (0,8); 7,2746 (0,8); 7,274 (0,8); 7,273 (0,9); 7,272 (1,1); 7,2714 (1,2); 7,2706 (1,5); 7,270 (1,8); 7,269 (2,1); 7,268 (2,2); 7,2674 (2,6); 7,2666 (3,1); 7,266 (3,8); 7,265 (5,0); 7,264 (7,0); 7,261 (299,5); 7,258 (4,5); 7,257 (2,9); 7,256 (2,3); 7,255 (1,6); 7,2543 (1,3); 7,2535 (1,2); 7,253 (0,8); 7,252 (0,7); 7,251 (0,6); 7,2503 (0,6); 7,2495 (0,6); 7,249 (0,5); 7,211 (1,6); 6,997 (1,7); 6,100 (4,4); 3,595 (1,3); 3,552 (6,2); 3,543 (4,0); 3,535 (16,0); 3,527 (4,0); 3,518 (6,5); 2,035 (5,0); 1,821 (12,8); 0,008 (3,6); 0,006 (0,9); 0,005 (1,0); 0,004 (1,3); 0,002 (4,1); 0,000 (136,1); -0,006 (1,2); -0,009 (3,6); -0,050 (0,6)
1-462	Me	SMe	Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,406 (1,0); 7,387 (1,3); 7,266 (0,5); 7,265 (0,7); 7,264 (0,9); 7,261 (25,8); 7,257 (0,7); 7,256 (0,5); 7,237 (1,0); 7,217 (0,8); 2,752 (7,4); 2,628 (7,1); 2,248 (16,0); 1,543 (2,0); 0,000 (11,2); -0,003 (0,7)
1-463	Me	SOMe	Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,519 (0,5); 7,512 (1,0); 7,492 (1,1); 7,310 (1,4); 7,260 (91,3); 7,210 (3,4); 7,156 (1,0); 7,136 (0,9); 6,996 (0,6); 4,225 (0,6); 2,867 (5,6); 2,611 (3,1); 2,577 (3,4); 1,538 (16,0); 1,489 (0,8); 0,050 (0,6); 0,008 (1,4); 0,000 (39,4); -0,009 (2,1); -0,050 (1,5)
1-464	Me	SO ₂ Me	Me	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,280 (0,5); 7,573 (1,9); 7,553 (2,0); 7,289 (2,0); 7,268 (2,4); 7,261 (34,4); 7,210 (0,8); 3,092 (16,0); 3,041 (0,5); 2,772 (11,4); 2,694 (10,1); 0,008 (0,6); 0,000 (13,7); -0,008 (0,7)
1-465	Et	SEt	CF ₃	
1-466	Et	SOEt	CF ₃	
1-467	Et	SO ₂ Et	CF ₃	

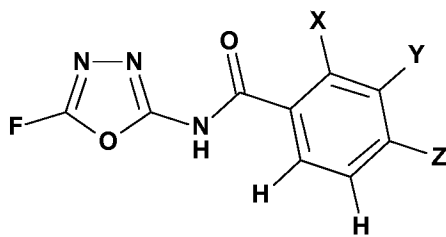
Nr.	X	Y	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-468	CH ₂ OMe	SMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,986 (0,7); 7,965 (1,1); 7,910 (1,8); 7,889 (1,0); 7,268 (0,6); 7,267 (0,7); 7,265 (1,0); 7,260 (58,5); 5,110 (6,3); 3,632 (16,0); 2,407 (10,1); 1,539 (7,2); 0,008 (0,7); 0,000 (25,1); -0,009 (0,7)
1-469	CH ₂ OMe	SOMe	CF ₃	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,914 (0,7); 7,893 (0,5); 7,309 (0,8); 7,260 (63,9); 7,209 (1,7); 5,874 (0,5); 5,847 (0,6); 5,014 (0,7); 4,987 (0,7); 3,642 (4,8); 3,086 (3,9); 1,538 (16,0); 1,488 (0,6); 0,008 (1,1); 0,000 (27,0); -0,009 (1,3); -0,051 (0,8)
1-470	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	CF ₃	
1-471	OMe	SEt	CHF ₂	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,356 (1,0); 8,335 (1,1); 7,695 (1,2); 7,674 (1,1); 7,392 (0,7); 7,262 (14,4); 7,254 (1,5); 7,117 (0,7); 4,171 (16,0); 2,986 (0,9); 2,967 (2,7); 2,949 (2,8); 2,930 (0,9); 1,549 (0,5); 1,249 (3,4); 1,231 (7,0); 1,212 (3,2); 0,000 (6,0)
1-472	OMe	S(O)Et	CHF ₂	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,383 (1,2); 8,363 (1,3); 8,085 (0,8); 7,948 (1,1); 7,903 (1,3); 7,901 (1,4); 7,882 (1,2); 7,880 (1,3); 7,811 (0,9); 7,263 (13,4); 4,093 (16,0); 4,042 (0,7); 3,488 (1,5); 3,347 (0,7); 3,329 (0,7); 3,315 (1,0); 3,296 (1,0); 3,188 (1,0); 3,169 (1,1); 3,155 (0,8); 3,136 (0,8); 1,446 (3,1); 1,428 (6,3); 1,409 (3,1); 0,000 (5,4)
1-473	OMe	SO ₂ Et	CHF ₂	¹ H-NMR (400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,480 (0,9); 8,459 (1,0); 7,966 (3,7); 7,945 (2,3); 7,830 (2,7); 7,693 (1,3); 7,261 (36,8); 7,211 (0,8); 4,158 (16,0); 3,527 (0,9); 3,508 (2,8); 3,490 (2,9); 3,471 (1,0); 1,546 (8,7); 1,380 (4,0); 1,361 (8,3); 1,343 (4,0); 0,008 (0,8); 0,000 (15,1); -0,009 (0,6)

Tabelle 2: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin A für CY, V und W für Wasserstoff und Hal für Brom steht. Tabelle 2 enthält 473 Verbindungen (2-1 bis 2-473), bei denen X, Y und Z wie in Tabelle 1 definiert sind.



5

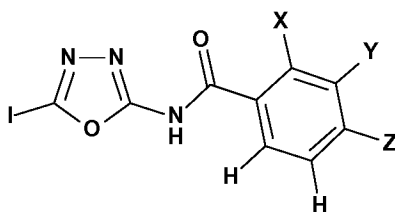
Tabelle 3: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin A für CY, V und W für Wasserstoff und Hal für Fluor steht. Tabelle 3 enthält 473 Verbindungen 3-1 bis 3-473), bei denen X, Y und Z wie in Tabelle 1 definiert sind.



10

15

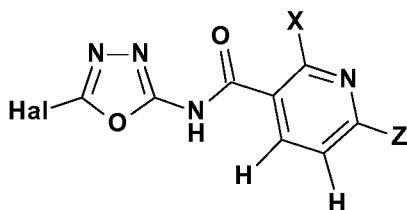
Tabelle 4: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin A für CY, V und W für Wasserstoff und Hal für Jod steht. Tabelle 4 enthält 473 Verbindungen (4-1 bis 4-473), bei denen X, Y und Z wie in Tabelle 1 definiert sind.



20

25

Tabelle 5: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin A für N und V und W für Wasserstoff stehen.



Nr.	Hal	X	Z	Physikalische Daten (¹ H-NMR, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
5-1	Cl	Cl	CF ₃	
5-2	Br	Cl	CF ₃	
5-3	F	Cl	CF ₃	
5-4	I	Cl	CF ₃	
5-5	Cl	Cl	Cl	
5-6	Br	Cl	Cl	
5-7	F	Cl	Cl	
5-8	I	Cl	Cl	
5-9	Cl	Me	Cl	
5-10	Br	Me	Cl	
5-11	F	Me	Cl	
5-12	I	Me	Cl	
5-13	Cl	Cl	SMe	
5-14	Br	Cl	SMe	
5-15	F	Cl	SMe	
5-16	I	Cl	SMe	
5-17	Cl	Cl	SO ₂ Me	
5-18	Br	Cl	SO ₂ Me	
5-19	F	Cl	SO ₂ Me	
5-20	I	Cl	SO ₂ Me	
5-21	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	
5-22	Br	CH ₂ OMe	CF ₃	
5-23	F	CH ₂ OMe	CF ₃	
5-24	I	CH ₂ OMe	CF ₃	
5-25	Cl	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	
5-26	Br	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	
5-27	F	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	
5-28	I	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	

B. Formulierungsbeispiele

- 5 a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- 10 b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 64 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoymethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- 15 c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykolether (®Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277 C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- 20 d) Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.
- 25 e) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten indem man 75 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Calcium, 5 Gew.-Teile Natriumlaurylsulfat, 3 Gew.-Teile Polyvinylalkohol und 7 Gew.-Teile Kaolin mischt, auf einer Stiftmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett durch Aufsprühen von 30 Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.
- 35 f) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man 25 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und/oder deren Salze, 5 Gew.-Teile 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium 2 Gew.-Teile oleoymethyltaurinsaures Natrium, 1 Gew.-Teil Polyvinylalkohol, 17 Gew.-Teile Calciumcarbonat und

50 Gew.-Teile Wasser

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

5

C. Biologische Beispiele

1. Herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen im Voraufbau

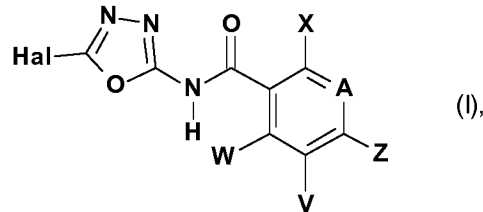
Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut- bzw. Kulturpflanzen werden in Holzfasertöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als
10 Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wäßrige Suspension bzw. Emulsion mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha unter Zusatz von 0,2% Netzmittel auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert. Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Testpflanzen gehalten. Die visuelle Bonitur der Schäden an den Versuchspflanzen erfolgt nach einer Versuchszeit von
15 3 Wochen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen (herbizide Wirkung in Prozent (%): 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0 % Wirkung = wie Kontrollpflanzen). Dabei zeigen beispielsweise die Verbindungen Nr. 1-028, 1-116, 1-143, 1-144, 1-145, 1-153, 1-161, 1-185, 1-242, 1-250, 1-255, 1-290, 1-310, 1-311, 1-359, 1-384, 1-385, 1-447, 1-451, 1-452, 1-454, 1-468 sowie 1-472 bei einer Aufwandmenge von 320 g/ha jeweils eine mindestens 80%-ige Wirkung gegen *Amaranthus retroflexus*, *Setaria viridis* und *Echinochloa crus galli*.
20

2. Herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen im Nachaufbau

Samen von mono- bzw. dikotylen Unkraut- bzw. Kulturpflanzen werden in Holzfasertöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen
25 angezogen. 2 bis 3 Wochen nach der Aussaat werden die Versuchspflanzen im Einblattstadium behandelt. Die in Form von benetzbaren Pulvern (WP) oder als Emulsionskonzentrate (EC) formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wäßrige Suspension bzw. Emulsion mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha unter Zusatz von 0,2% Netzmittel auf die grünen Pflanzenteile gesprüht. Nach ca. 3 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus
30 unter optimalen Wachstumsbedingungen wird die Wirkung der Präparate visuell im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert (herbizide Wirkung in Prozent (%): 100% Wirkung = Pflanzen sind abgestorben, 0 % Wirkung = wie Kontrollpflanzen).
Dabei zeigen beispielsweise die Verbindungen Nr. 1-143, 1-145, 1-153, 1-161, 1-185, 1-250, 1-290, 1-384, 1-385, 1-448, 1-451, 1-454, 1-455, 1-461, 1-469 sowie 1-472 bei einer Aufwandmenge von 80 g/ha
35 jeweils eine mindestens 80 %-ige Wirkung gegen *Amaranthus retroflexus*, *Setaria viridis* und *Echinochloa crus galli*.

Patentansprüche

1. N-(5-Halogen-1,3,4-Oxadiazol-2-yl)arylcarsäureamide der Formel (I) und deren Salze



5

worin die Substituenten folgende Bedeutungen haben:

A bedeutet N oder CY,

10

Hal bedeutet Halogen,

X bedeutet Nitro, Halogen, Cyano, Formyl, Rhodano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, Halogen-(C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-Alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl, wobei die beiden letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy und Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

20

25

Y bedeutet Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkenyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-Alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CN, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-Phenyl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl, Phenyl,

30

Heteroaryl oder Heterocyclyl, wobei die 6 letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl und Cyanomethyl substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

5

Z bedeutet Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, Halogen-(C₂-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Halogen-(C₃-C₆)-cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂,

10

OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-S(O)_nR², (C₁-C₆)-Alkyl-OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OCOR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-OSO₂R², (C₁-C₆)-Alkyl-CO₂R¹, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-Alkyl-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, Heteroaryl, Heterocyclyl oder Phenyl, wobei die drei letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Nitro,

15

Cyano, (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, S(O)_n-(C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy und Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt, oder

V bedeutet Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Halogenalkyl, OR¹, S(O)_nR²,

20

W bedeutet Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Halogenalkyl, OR¹, S(O)_nR²,

R¹ bedeutet Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-

Halogenalkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkenyl,

25

(C₃-C₆)-Halogencycloalkyl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Phenyl,

Phenyl-(C₁-C₆)-alkyl, Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, Heterocycl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl,

(C₁-C₆)-Alkyl-O-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-NR³-Heteroaryl, (C₁-C₆)-

Alkyl-NR³-Heterocyclyl wobei die 21 letztgenannten Reste durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus

Cyano, Halogen, Nitro, Rhodano, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³,

30

NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ und (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₂-C₆)-alkoxycarbonyl substituiert sind,

und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

R² bedeutet (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Halogenalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Halogenalkenyl, (C₂-C₆)-

Alkynyl, (C₂-C₆)-Halogenalkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkenyl, (C₃-C₆)-Halogencycloalkyl,

35

(C₁-C₆)-Alkyl-O-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, Phenyl, Phenyl-(C₁-C₆)-alkyl,

Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-

Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-NR³-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-NR³-

Heterocyclyl wobei die 21 letztgenannten Reste durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Halogen, Nitro, Rhodano, OR^3 , $S(O)_nR^4$, $N(R^3)_2$, NR^3OR^3 , COR^3 , $OCOR^3$, $SCOR^4$, NR^3COR^3 , $NR^3SO_2R^4$, CO_2R^3 , $COSR^4$, $CON(R^3)_2$ und (C_1-C_4) -Alkoxy- (C_2-C_6) -alkoxycarbonyl substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

5

R^3 bedeutet Wasserstoff, (C_1-C_6) -Alkyl, (C_2-C_6) -Alkenyl, (C_2-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_6) -Cycloalkyl oder (C_3-C_6) -Cycloalkyl- (C_1-C_6) -alkyl,

R^4 bedeutet (C_1-C_6) -Alkyl, (C_2-C_6) -Alkenyl oder (C_2-C_6) -Alkynyl,

10

R^5 bedeutet Methyl oder Ethyl,

n bedeutet 0, 1 oder 2,

15

s bedeutet 0, 1, 2 oder 3,

mit der Maßgabe, dass die Verbindung N^1 -(5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl)- N^2,N^2 -diethyl-3-iodphthalamid ausgenommen ist.

20

2. N-(5-Halogen-1,3,4-Oxadiazol-2-yl)arylcarbonsäureamide nach Anspruch 1, worin

A bedeutet N oder CY,

Hal bedeutet Chlor,

25

X bedeutet Nitro, Halogen, Cyano, (C_1-C_6) -Alkyl, Halogen- (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -Cycloalkyl, OR^1 , $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) -Alkyl- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) -Alkyl- OR^1 , (C_1-C_6) -Alkyl- $CON(R^1)_2$, (C_1-C_6) -Alkyl- $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) -Alkyl- NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -Alkyl- $NR^1SO_2R^2$, (C_1-C_6) -Alkyl-Heteroaryl, (C_1-C_6) -Alkyl-Heterocyclyl, wobei die beiden letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen, (C_1-C_6) -Alkyl, Halogen- (C_1-C_6) -alkyl, $S(O)_n$ - (C_1-C_6) -Alkyl, (C_1-C_6) -Alkoxy und Halogen- (C_1-C_6) -alkoxy substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

30

Y Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, (C_1-C_6) -Alkyl, (C_1-C_6) -Halogenalkyl, OR^1 , $S(O)_nR^2$, $SO_2N(R^1)_2$, $N(R^1)_2$, $NR^1SO_2R^2$, NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -Alkyl- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) -Alkyl- OR^1 , (C_1-C_6) -Alkyl- $CON(R^1)_2$, (C_1-C_6) -Alkyl- $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) -Alkyl- NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -Alkyl- $NR^1SO_2R^2$, (C_1-C_6) -Alkyl-Phenyl, (C_1-C_6) -Alkyl-Heteroaryl, (C_1-C_6) -Alkyl-Heterocyclyl, Phenyl, Heteroaryl oder Heterocyclyl, wobei die 6 letztgenannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_6) -Alkyl, Halogen- (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -Cycloalkyl, $S(O)_n$ - (C_1-C_6) -

35

Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl und Cyanomethyl substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

5 Z bedeutet Wasserstoff, Halogen, Methyl, Ethyl, Isopropyl, Halogen-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, S(O)_nR² oder

V bedeutet Wasserstoff,

W bedeutet Wasserstoff,

10

R¹ bedeutet Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-(C₁-C₆)-alkyl, Phenyl, Phenyl-(C₁-C₆)-alkyl, Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heteroaryl, Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-Heteroaryl, (C₁-C₆)-Alkyl-O-Heterocyclyl, (C₁-C₆)-Alkyl-NR³-Heteroaryl oder (C₁-C₆)-Alkyl-NR³-Heterocyclyl, wobei
15 die 16 letztgenannten Reste durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Halogen, Nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ und (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₂-C₆)-alkoxycarbonyl substituiert sind, und wobei Heterocyclyl n Oxogruppen trägt,

20 R² bedeutet (C₁-C₆)-Alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl oder (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkyl, wobei diese drei vorstehend genannten Reste jeweils durch s Reste aus der Gruppe bestehend aus Halogen und OR³ substituiert sind,

R³ bedeutet Wasserstoff oder (C₁-C₆)-Alkyl,

25 R⁴ bedeutet (C₁-C₆)-Alkyl,

n bedeutet 0, 1 oder 2,

s bedeutet 0, 1, 2 oder 3.

30

3. Herbizide Mittel nach Anspruch 1 oder 2 in Mischung mit Formulierungshilfsmitteln.

35 4. Herbizide Mittel nach Anspruch 3 enthaltend mindestens einen weiteren pestizid wirksamen Stoff aus der Gruppe Insektizide, Akarizide, Herbizide, Fungizide, Safener und Wachstumsregulatoren.

5. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2 oder eines herbiziden Mittels nach Anspruch 3 oder 4 auf die Pflanzen oder auf den Ort des unerwünschten Pflanzenwachstums appliziert.

5

6. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2 oder von herbiziden Mitteln nach Anspruch 3 oder 4 zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

7. Verwendung nach Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, daß die Verbindungen der Formel (I) zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen in Kulturen von Nutzpflanzen eingesetzt werden.

10

8. Verwendung nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß die Nutzpflanzen transgene Nutzpflanzen sind.

15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2017/053763

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D271/113 C07D413/12 A01N43/82
ADD.

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D A01N

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; AHRENS HARTMUT [DE]; BRAU) 27 September 2012 (2012-09-27) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele. -----	1-8
A	EP 1 193 254 A1 (NIHON NOHYAKU CO LTD [JP]) 3 April 2002 (2002-04-03) Zusammenfassung; Ansprüche; Seite 15, allgemeine Formel (I) in Kombination mit Seite 27, No. 19-33 (CAS-RN 1323325-77-1) entsprechend der vom vorliegenden Anspruch 1 ausgenommenen Verbindung. ----- -/--	1-8

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search 13 March 2017	Date of mailing of the international search report 24/03/2017
--	--

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2017/053763

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1975, El-Dine; Hazzaa: "Chemical studies in the field of oral hypoglycemic agents. III", XP002756342, retrieved from STN Database accession no. 1975:531514 abstract & JOURNAL OF DRUG RESEARCH, vol. 6, no. 3, 1974, pages 203-207, -----</p>	1-8
A	<p>CH 570 759 A5 (CIBA GEIGY AG) 31 December 1975 (1975-12-31) Spalte 1, Zeilen 1-13; Ansprüche; Beispiel 2, Spalte 6, Tabelle: Einträge mit R = Phenyl. -----</p>	1-8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2017/053763

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012126932	A1	27-09-2012	
		AR 085469 A1	02-10-2013
		AU 2012230388 A1	03-10-2013
		BR 112013023911 A2	09-08-2016
		CA 2830773 A1	27-09-2012
		CN 103596946 A	19-02-2014
		DK 2688885 T3	12-09-2016
		EA 201391320 A1	28-02-2014
		EP 2688885 A1	29-01-2014
		ES 2588999 T3	08-11-2016
		HR P20161113 T1	02-12-2016
		JP 6023783 B2	09-11-2016
		JP 2014510088 A	24-04-2014
		KR 20140027953 A	07-03-2014
		LT 2688885 T	12-09-2016
		PL 2688885 T3	30-12-2016
		SI 2688885 T1	28-10-2016
		US 2014080705 A1	20-03-2014
		WO 2012126932 A1	27-09-2012
		ZA 201307815 B	29-04-2015

EP 1193254	A1	03-04-2002	
		AR 030154 A1	13-08-2003
		AU 773377 B2	20-05-2004
		BR 0012224 A	28-05-2002
		CN 1360573 A	24-07-2002
		CO 5221024 A1	28-11-2002
		CZ 20020039 A3	15-05-2002
		EG 22172 A	31-10-2002
		EP 1193254 A1	03-04-2002
		HU 0202190 A2	28-09-2002
		JP 5311072 B2	09-10-2013
		JP 2011074077 A	14-04-2011
		KR 100429276 B1	29-04-2004
		PL 353389 A1	17-11-2003
		TR 200200210 T2	21-06-2002
		US 6875768 B1	05-04-2005
		WO 0102354 A1	11-01-2001

CH 570759	A5	31-12-1975	NONE

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D271/113 C07D413/12 A01N43/82 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; AHRENS HARTMUT [DE]; BRAU) 27. September 2012 (2012-09-27) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele. -----	1-8
A	EP 1 193 254 A1 (NIHON NOHYAKU CO LTD [JP]) 3. April 2002 (2002-04-03) Zusammenfassung; Ansprüche; Seite 15, allgemeine Formel (I) in Kombination mit Seite 27, No. 19-33 (CAS-RN 1323325-77-1) entsprechend der vom vorliegenden Anspruch 1 ausgenommenen Verbindung. ----- -/--	1-8
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist		"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 13. März 2017		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts 24/03/2017
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Weisbrod, Thomas

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	<p>DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1975, El-Dine; Hazzaa: "Chemical studies in the field of oral hypoglycemic agents. III", XP002756342, gefunden im STN Database accession no. 1975:531514 Zusammenfassung & JOURNAL OF DRUG RESEARCH, Bd. 6, Nr. 3, 1974, Seiten 203-207, -----</p>	1-8
A	<p>CH 570 759 A5 (CIBA GEIGY AG) 31. Dezember 1975 (1975-12-31) Spalte 1, Zeilen 1-13; Ansprüche; Beispiel 2, Spalte 6, Tabelle: Einträge mit R = Phenyl. -----</p>	1-8

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2017/053763

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2012126932	A1	27-09-2012	AR 085469 A1 02-10-2013
			AU 2012230388 A1 03-10-2013
			BR 112013023911 A2 09-08-2016
			CA 2830773 A1 27-09-2012
			CN 103596946 A 19-02-2014
			DK 2688885 T3 12-09-2016
			EA 201391320 A1 28-02-2014
			EP 2688885 A1 29-01-2014
			ES 2588999 T3 08-11-2016
			HR P20161113 T1 02-12-2016
			JP 6023783 B2 09-11-2016
			JP 2014510088 A 24-04-2014
			KR 20140027953 A 07-03-2014
			LT 2688885 T 12-09-2016
			PL 2688885 T3 30-12-2016
			SI 2688885 T1 28-10-2016
			US 2014080705 A1 20-03-2014
			WO 2012126932 A1 27-09-2012
			ZA 201307815 B 29-04-2015

EP 1193254	A1	03-04-2002	AR 030154 A1 13-08-2003
			AU 773377 B2 20-05-2004
			BR 0012224 A 28-05-2002
			CN 1360573 A 24-07-2002
			CO 5221024 A1 28-11-2002
			CZ 20020039 A3 15-05-2002
			EG 22172 A 31-10-2002
			EP 1193254 A1 03-04-2002
			HU 0202190 A2 28-09-2002
			JP 5311072 B2 09-10-2013
			JP 2011074077 A 14-04-2011
			KR 100429276 B1 29-04-2004
			PL 353389 A1 17-11-2003
			TR 200200210 T2 21-06-2002
			US 6875768 B1 05-04-2005
			WO 0102354 A1 11-01-2001

CH 570759	A5	31-12-1975	KEINE
