

**PCT**WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales BüroINTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)(51) Internationale Patentklassifikation<sup>6</sup> :C07D 251/18, A01N 43/68, C07D 251/50,  
251/52

A1

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: **WO 98/15536**(43) Internationales  
Veröffentlichungsdatum:

16. April 1998 (16.04.98)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP97/05317

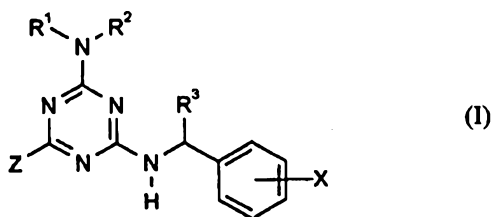
(22) Internationales Anmeldedatum: 29. September 1997  
(29.09.97)(30) Prioritätsdaten:  
196 41 692.2 10. Oktober 1996 (10.10.96) DE(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER  
AKTIENGESSELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen  
(DE). NIHON BAYER AGROCHEM K.K. [JP/JP]; 10-8,  
Takanawa 4-chome, Minato-ku, Tokyo 108 (JP).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): RIEBEL, Hans-Jochem  
[DE/DE]; In der Beek 92, D-42113 Wuppertal (DE). LEHR,  
Stefan [DE/DE]; Am Benthal 54, D-51381 Leverkusen  
(DE). STELZER, Uwe [DE/DE]; Adolf-Kolping-Strasse  
22a, D-51399 Burscheid (DE). WATANABE, Yukiyo  
[JP/JP]; 2-8-24, Hanagaki-cho, Oyama-shi, Tochigi 323  
(JP). DOLLINGER, Markus [DE/DE]; Burscheider Strasse  
154b, D-51381 Leverkusen (DE). SEISHI, Ito [JP/JP];  
2-12-3, Johtoh, Oyama-shi, Tochigi 323 (JP). GOTO,  
Toshio [JP/JP]; 214-18, Koganei, Kokubunji-machi, Shi-  
motsuga-gun, Tochigi 329-04 (JP). YANAGI, Akihiko  
[JP/JP]; 214-1, Oaza-Oyama, Oyama-shi, Tochigi 323 (JP).(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-  
SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG,  
BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB,  
GE, GH, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,  
LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO,  
NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR,  
TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ARIPO Patent (GH, KE,  
LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ,  
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT,  
BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC,  
NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).**Veröffentlicht***Mit internationalem Recherchenbericht.**Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen  
Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen  
eintreffen.*

(54) Title: SUBSTITUTED 2,4-DIAMINO-1,3,5-TRIAZINES AS HERBICIDES

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE 2,4-DIAMINO-1,3,5-TRIAZINE ALS HERBIZIDE

**(57) Abstract**

The invention relates to novel substituted 2,4-diamino-1,3,5-triazines of formula (I), (in which R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X and Z have the meaning cited in the description), methods and new intermediate products for their production and their use as herbicides.

**(57) Zusammenfassung**

Die Erfindung betrifft neue substituierte 2,4-Diamino-1,3,5-triazine der Formel (I), (worin R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X und Z die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben), Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

### **LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

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

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

## SUBSTITUIERTE 2,4-DIAMINO-1,3,5-TRIAZINE ALS HERBIZIDE

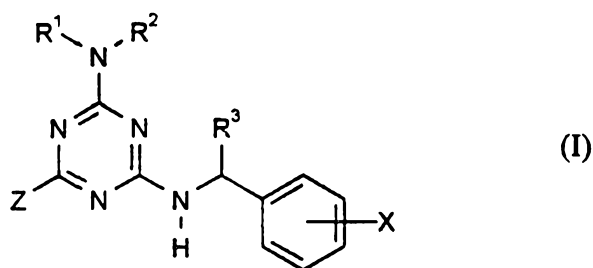
Die Erfindung betrifft neue substituierte 2,4-Diamino-1,3,5-triazine, Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

5

Eine Reihe von substituierten 2,4-Diamino-triazinen ist bereits aus der (Patent)-Literatur bekannt (vgl. US 3816419, US 3932167, EP 191496, EP 273328, EP 411153 / WO 90/09378, JP 62294669 - zitiert in Chem. Abstracts 109: 129062v). Diese Verbindungen haben jedoch bisher keine besondere Bedeutung erlangt.

10

Es wurden nun die neuen substituierten 2,4-Diamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I) gefunden,



15

in welcher

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

20

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, für Formyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy-carbonyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiertes Phenylcarbonyl, Naphthylcarbonyl, Phenylsulfonyl oder Naphthylsulfonyl steht,

25

R<sup>3</sup> für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

5

X für einen Substituenten aus folgender Gruppe steht:

10

Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano oder Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl-carbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, und

15

Z für Wasserstoff, Hydroxy, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

20

25

wobei jedoch die (aus JP 62294669 bekannten) Verbindungen

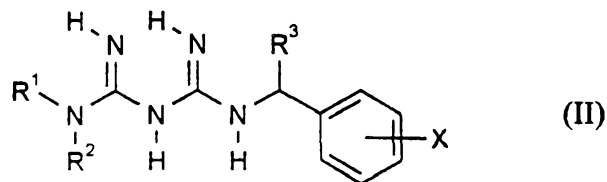
30

2-Amino-4-methoxy-6-[1-(3-chlor-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-methoxy-6-[1-(3-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-nitro-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-chlor-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin und 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin

ausgeschlossen sind.

Man erhält die neuen substituierten 2,4-Diamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I), wenn man

(a) substituierte Biguanide der allgemeinen Formel (II)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und X die oben angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) -

mit Alkoxycarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (III)



in welcher

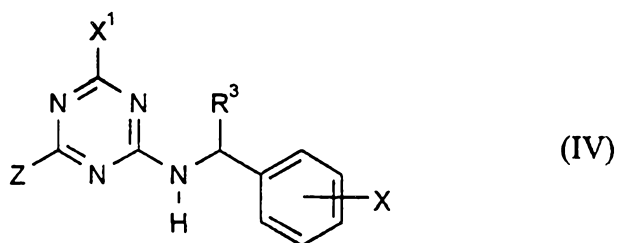
Z die oben angegebene Bedeutung hat und

$R'$  für Alkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder wenn man

(b) substituierte Aminotriazine der allgemeinen Formel (IV)

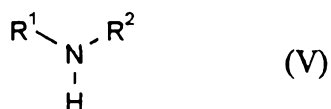


in welcher

$R^3$ , X und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

$X^1$  für Halogen oder Alkoxy steht,

mit Stickstoffverbindungen der allgemeinen Formel (V)



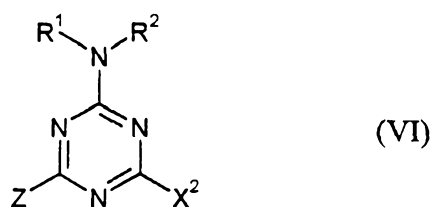
in welcher

$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder wenn man

(c) substituierte Aminotriazine der allgemeinen Formel (VI)



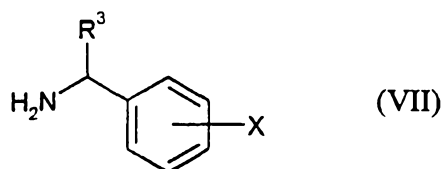
in welcher

5 R¹, R² und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

X² für Halogen oder Alkoxy steht,

mit Aminoverbindungen der allgemeinen Formel (VII)

10



in welcher

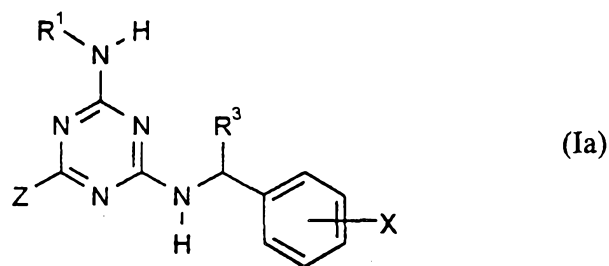
15 R³ und X die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

20 oder wenn man

(d) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I), ausgenommen solche mit R² = H, 2,4-Diamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (Ia)

25



in welcher

5  $R^1$ ,  $R^3$ , X und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Alkylierungs-, Acylierungs- oder Sulfonylierungsmitteln der allgemeinen Formel (VIII)

10  $Y-R^2$  (VIII)

in welcher

15  $R^2$  die oben angegebene Bedeutung - ausgenommen Wasserstoff - hat und

Y für Halogen, Alkoxy, Alkoxysulfonyloxy oder Acyloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

20

und gegebenenfalls an den gemäß den unter (a), (b), (c) oder (d) beschriebenen Verfahren erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der obigen Substituentendefinition weitere Umwandlungen nach üblichen Methoden durchführt.

25

Die neuen substituierten 2,4-Diamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.



Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) enthalten mindestens ein asymmetrisch substituiertes Kohlenstoffatom und können deshalb in verschiedenen enantiomeren (R- und S- konfigurierten Formen) bzw. diastereomeren Formen vorliegen. Die Erfindung betrifft sowohl die verschiedenen möglichen  
5 einzelnen enantiomeren bzw. stereoisomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wie auch die Gemische dieser isomeren Verbindungen.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy oder Alkylthio - jeweils geradkettig oder verzweigt.

Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise Verbindungen der Formel (I), in  
15 welcher

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

20 R<sup>2</sup> für Wasserstoff, für Formyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy-carbonyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes  
25 Phenylcarbonyl oder Phenylsulfonyl steht,

30 R<sup>3</sup> für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

X für einen Substituenten aus folgender Gruppe steht:

5 Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Iod, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor oder Chlor substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, 10 Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, und

15 Z für Wasserstoff, Hydroxy, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils 20 gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

wobei jedoch die (aus JP 62294669 bekannten) Verbindungen

25 2-Amino-4-methoxy-6-[1-(3-chlor-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-methoxy-6-[1-(3-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-nitro-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-chlor-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin und 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin 30 triazin

ausgeschlossen sind.

Die Erfindung betrifft insbesondere Verbindungen der Formel (I), in welcher

- 5         $R^1$     für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,
- 10         $R^2$     für Wasserstoff, für Formyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Phenylcarbonyl oder Phenylsulfonyl steht,
- 15         $R^3$     für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,
- 20        X      für einen Substituenten aus folgender Gruppe steht:
- 25            Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, und
- 30            Z      für Wasserstoff, Hydroxy, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Acetyl,

Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl oder Butinyl steht,

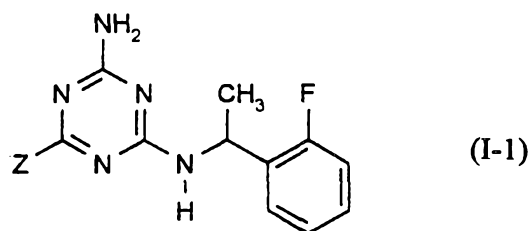
wobei jedoch die (aus JP 62294669 vorbekannten) Verbindungen

2-Amino-4-methoxy-6-[1-(3-chlor-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-methoxy-6-[1-(3-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-nitro-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-chlor-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin und 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin

ausgeschlossen sind.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt. Die allgemeinen Formeln stehen hierbei jeweils für die R-Enantiomeren, die S-Enantiomeren und die Racemate.

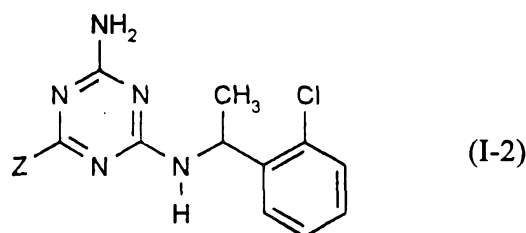
Gruppe 1

5 Z hat hierbei beispielhaft die nachfolgend angegebenen Bedeutungen:

Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Fluormethyl, Di-  
fluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Dichlormethyl, Chlorfluormethyl, Chlor-  
brommethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Bromdifluormethyl, Trichlor-  
methyl, 1-Fluor-ethyl, 2-Fluor-ethyl, 1-Chlor-ethyl, 2-Chlor-ethyl, 1-Chlor-1-fluor-  
ethyl, 1-Fluor-propyl, 2-Fluor-propyl, 3-Fluor-propyl, 1-Fluor-1-methyl-ethyl, 2-  
Fluor-1-methyl-ethyl, 1-Chlor-1-methyl-ethyl, 1-Fluor-1-methyl-propyl, 1-Chlor-1-  
ethyl-propyl, 1-Fluor-1-ethyl-propyl, 1-Chlor-1-ethyl-propyl, 1-Fluor-2-methyl-  
propyl, 1-Chlor-2-methyl-propyl, 1-Chlor-propyl, 2-Chlor-propyl, 3-Chlor-propyl, 1-  
Chlor-1-methyl-ethyl, 2-Chlor-1-methyl-ethyl, 1,1-Difluor-ethyl, 1,2-Difluor-ethyl,  
1,1-Dichlor-ethyl, 2,2,2-Trifluor-ethyl, 1,2,2,2-Tetrafluor-ethyl, Perfluorethyl, 1,1-  
Difluor-propyl, 1,1-Dichlor-propyl, Perfluorpropyl, 1-Fluor-butyl, 1-Chlor-butyl, Per-  
fluorpentyl, Perfluorhexyl, 1-Hydroxy-ethyl, Acetyl, 1,1-Bis-acetyl-methyl, 1-Acetyl-  
1-methoxycarbonyl-methyl, 1-Acetyl-1-ethoxycarbonyl-methyl, Methoxymethyl, 1,1-  
Dimethoxy-methyl, 1-Methoxyethyl, 2-Methoxy-ethyl, 1,1-Dimethoxy-ethyl, Ethoxy-  
methyl, 1-Ethoxyethyl, 2-Ethoxy-ethyl, 2-Methoxy-1-methyl-ethyl, 2-Methoxy-1-  
ethyl-ethyl, 2-Ethoxy-1-methyl-ethyl, 2-Ethoxy-1-ethyl-ethyl, Methylthiomethyl,  
Ethylthiomethyl, 1-Methylthio-ethyl, 2-Methylthioethyl, 1-Ethylthio-ethyl, 2-Ethyl-  
thioethyl, Methylsulfinylmethyl, Ethylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Ethyl-  
sulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i- Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder  
i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Fluor-  
methoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Fluorethoxy, Difluorethoxy, Trifluor-  
ethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Vinyl, 1-Chlor-vinyl, 2-Chlor-vinyl, 1-  
Fluor-vinyl, 2-Fluor-vinyl, 1-Brom-vinyl, 2-Brom-vinyl, 1,2-Dichlor-vinyl, 1,2-

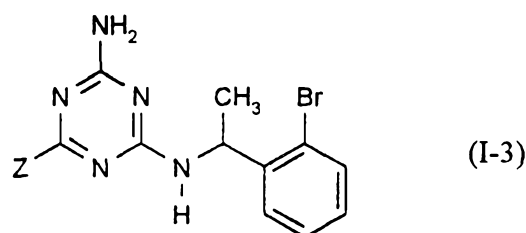
Dibrom-vinyl, 1,2-Difluor-vinyl, 2,2-Dichlor-vinyl, 2,2-Difluor-vinyl, 2,2-Dibrom-vinyl, 1-Chlor-2-fluor-vinyl, 2-Brom-2-chlor-vinyl, Trichlorvinyl, Allyl, 2-Chlor-allyl, 3-Chlor-allyl, 3,3-Dichlor-allyl, 1-Propenyl, Isopropenyl, 1-Chlor-2-propenyl, 1-Fluor-2-propenyl, 1-Brom-2-propenyl, 1,2-Dichlor-1-propenyl, 1,2-Dibrom-1-propenyl, 1,2-Difluor-1-propenyl, 1,1-Dichlor-2-propenyl, 1,1-Dibrom-2-propenyl, 1,1-Difluor-2-propenyl, 1,1,3,3,3-Pentafluor-2-propenyl, 2-Buten-1-yl, 2-Buten-2-yl, 3-Chlor-2-butenyl, 3-Brom-2-butenyl, 3,3,3-Trifluor-2-butenyl, Ethinyl, 2-Chlor-ethinyl, 2-Brom-ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 3,3,3-Trifluor-1-propinyl.

10 Gruppe 2



Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

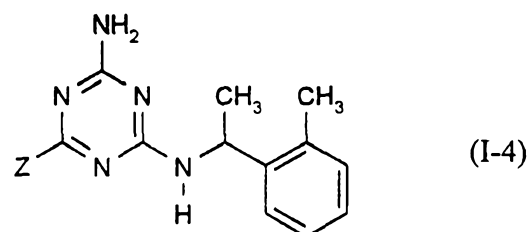
Gruppe 3



15

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

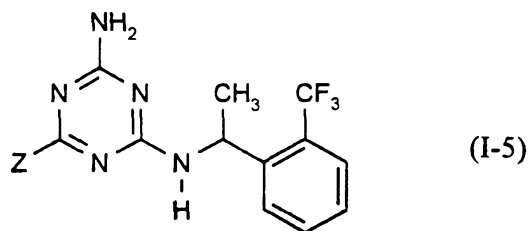
Gruppe 4



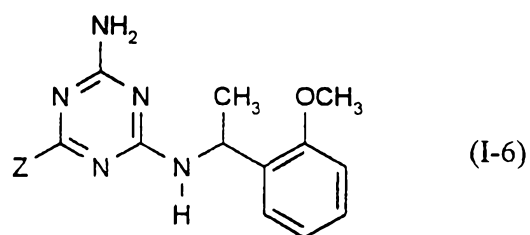
20

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

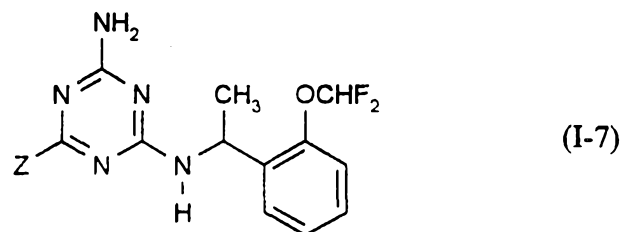
13.

Gruppe 5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

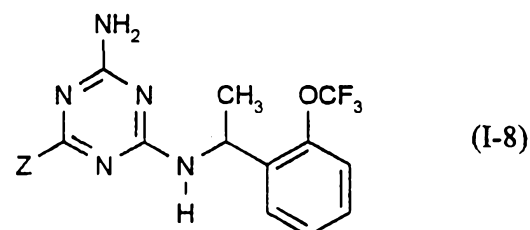
5 Gruppe 6

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 7

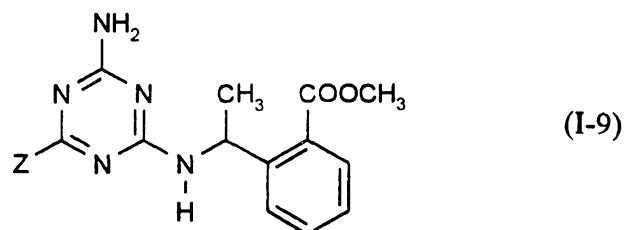
10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

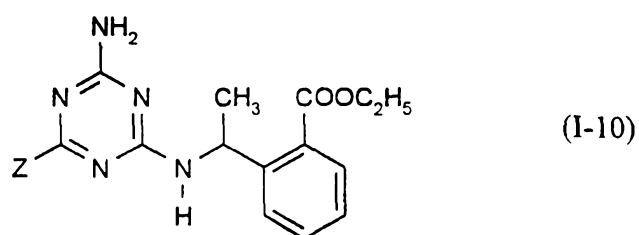
Gruppe 8

15

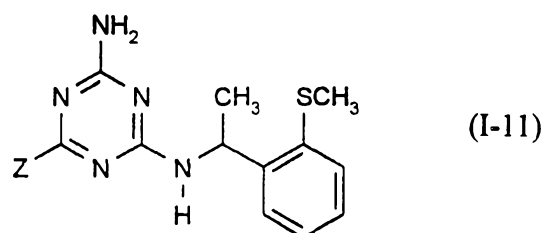
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 9

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

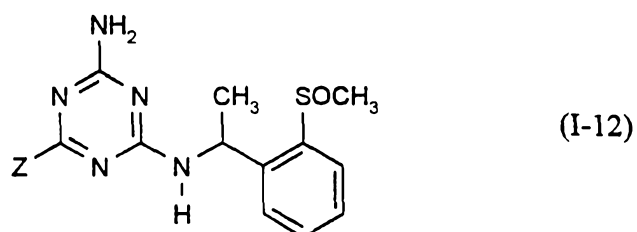
5 Gruppe 10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 11

10

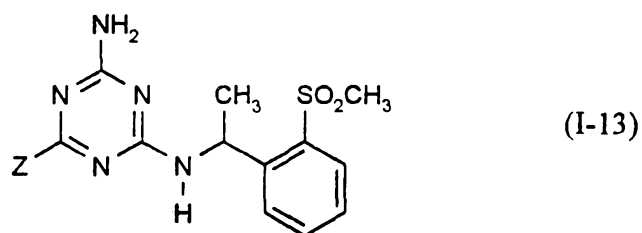
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 12

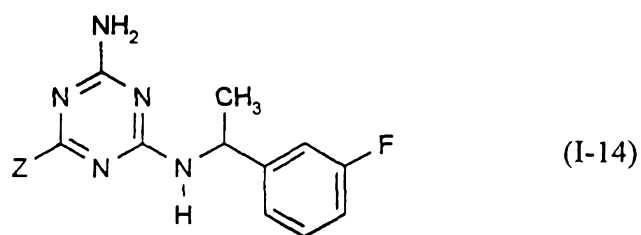
15

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

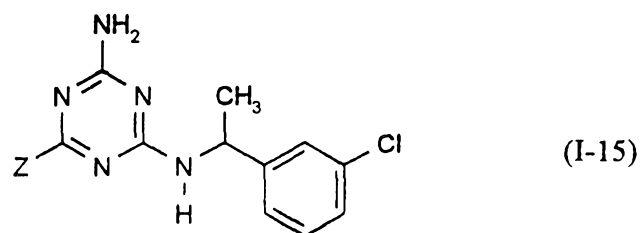


Gruppe 13

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

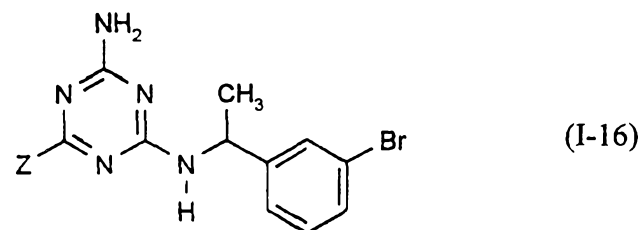
5 Gruppe 14

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 15

10

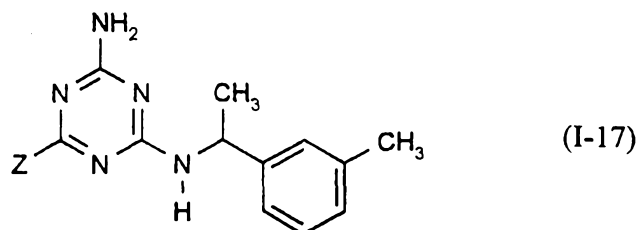
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 16

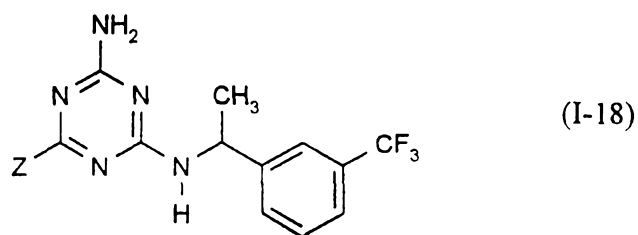
15

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

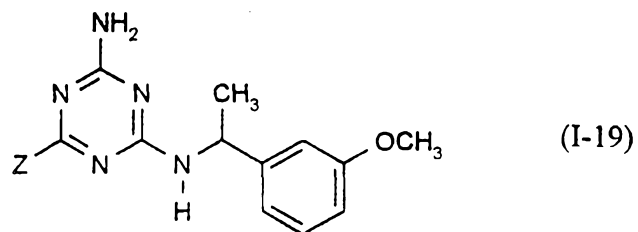
16

Gruppe 17

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

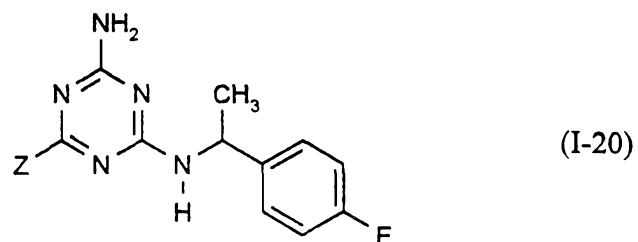
5 Gruppe 18

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 19

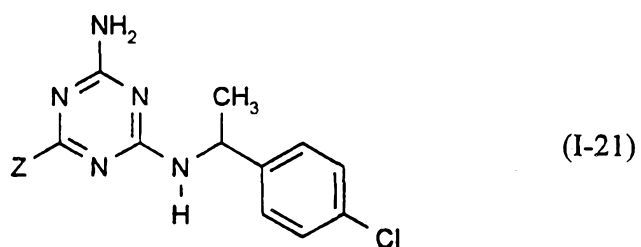
10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

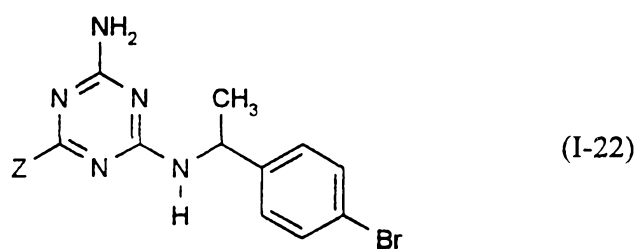
Gruppe 20

15

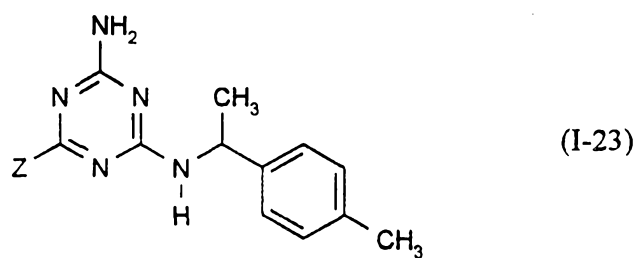
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 21

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

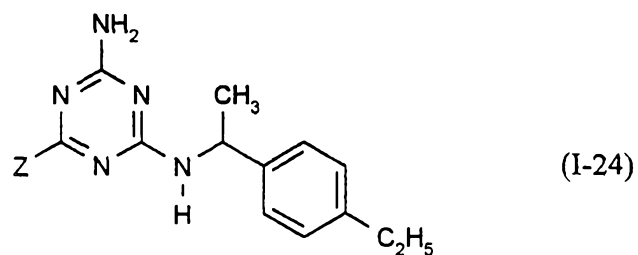
5 Gruppe 22

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 23

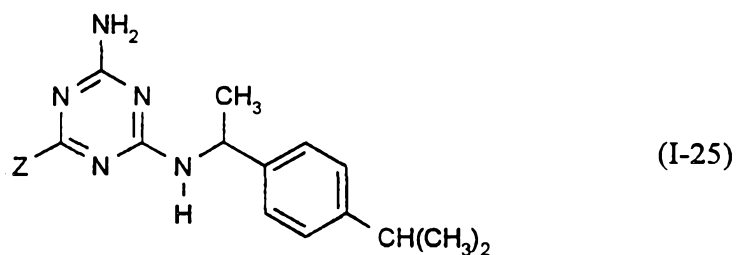
10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

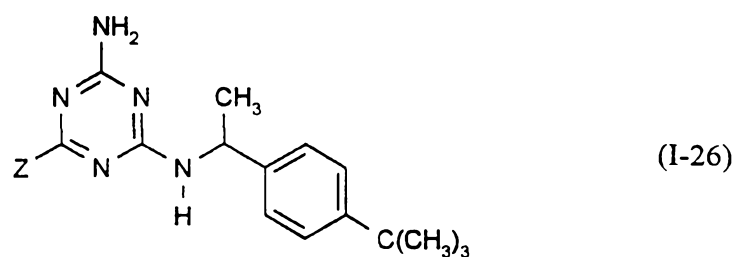
Gruppe 24

15

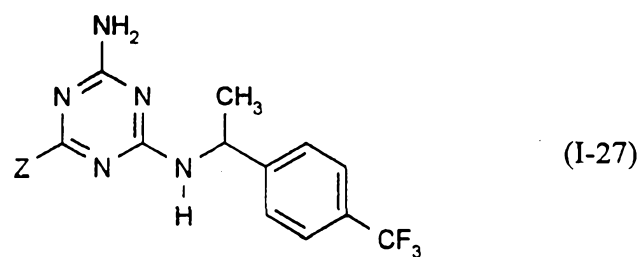
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 25

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

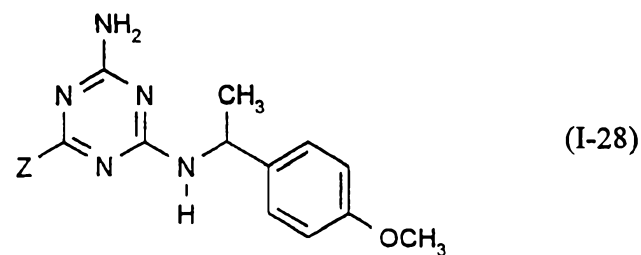
5 Gruppe 26

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 27

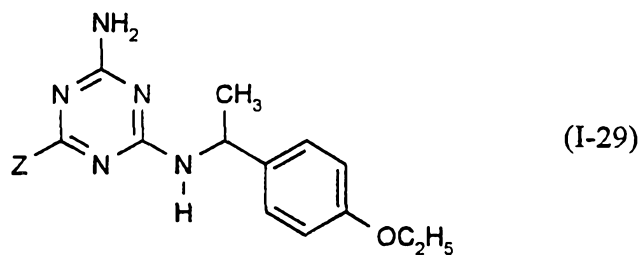
10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

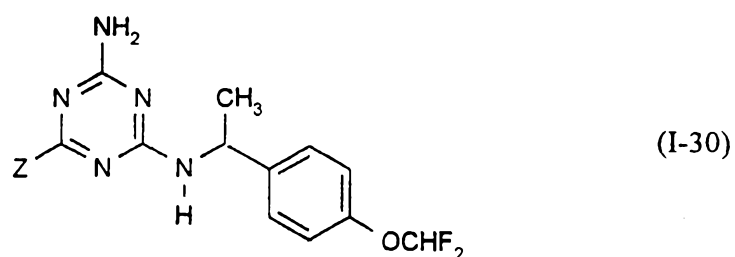
Gruppe 28

15

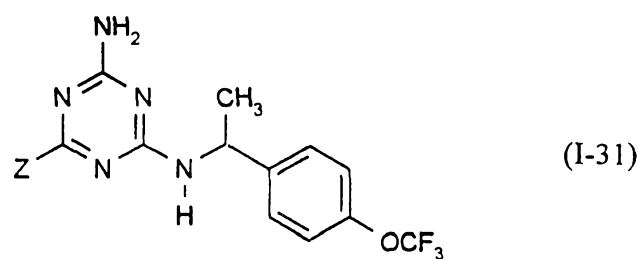
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 29

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

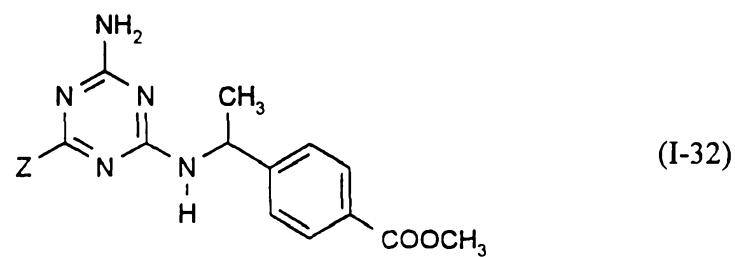
5 Gruppe 30

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 31

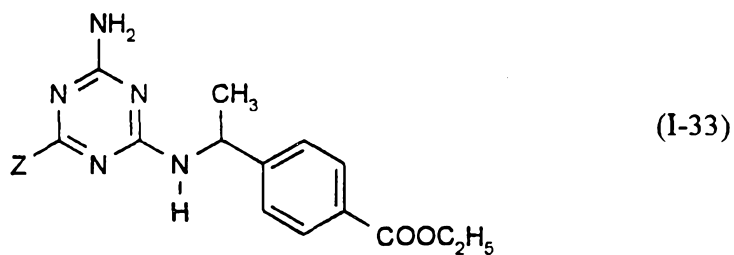
10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

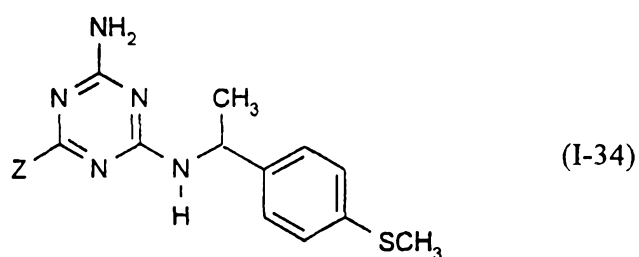
Gruppe 32

15

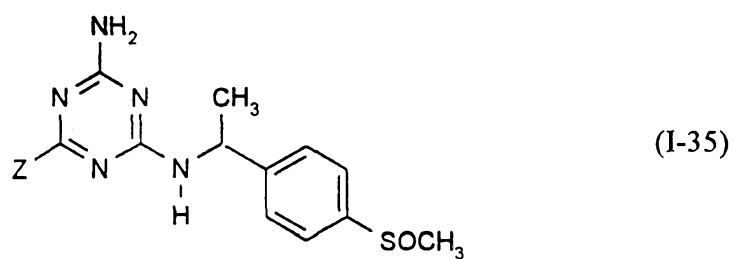
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 33

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

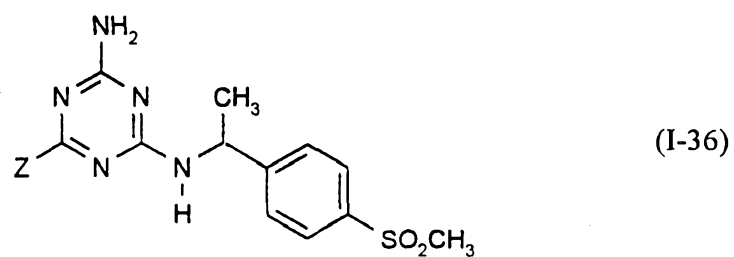
5 Gruppe 34

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 35

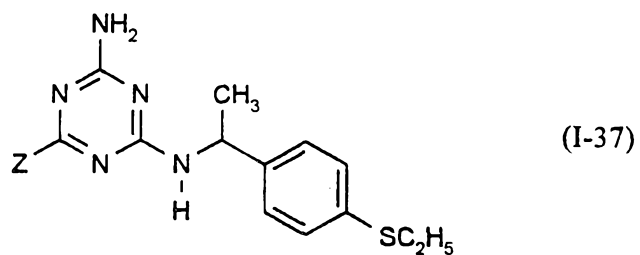
10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

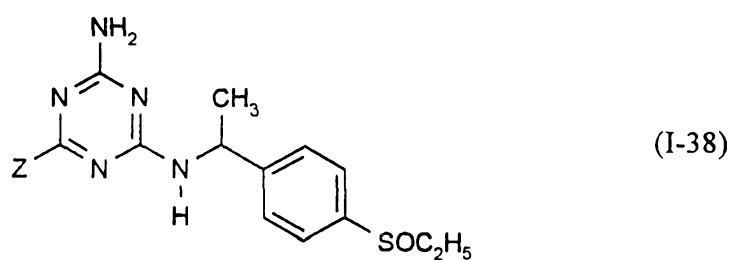
Gruppe 36

15

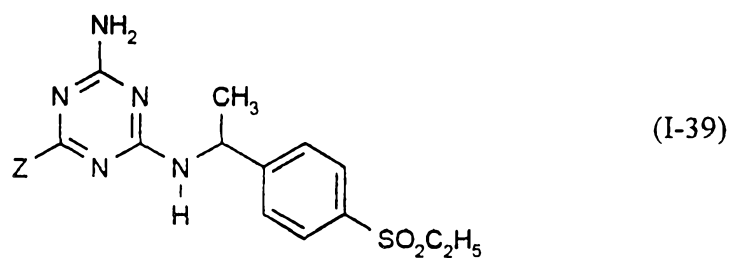
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 37

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

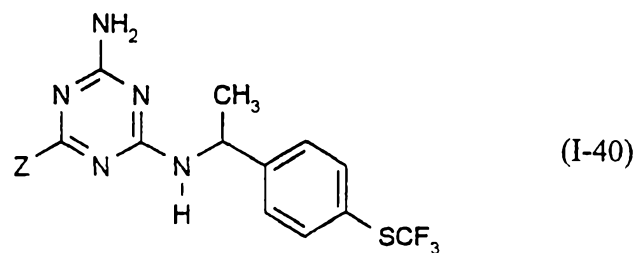
5 Gruppe 38

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 39

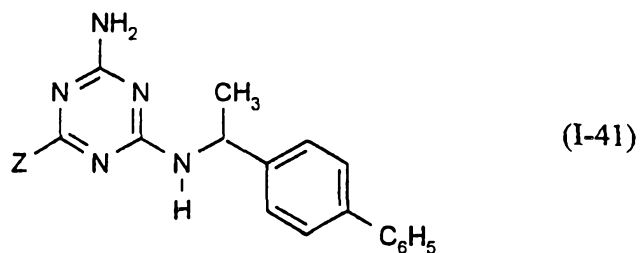
10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

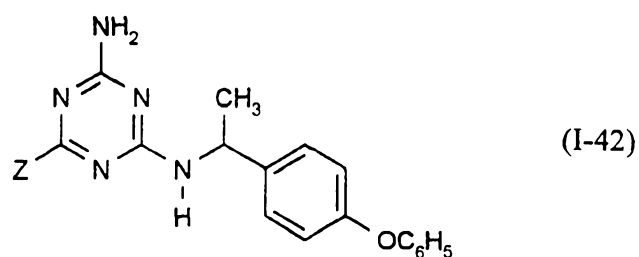
Gruppe 40

15

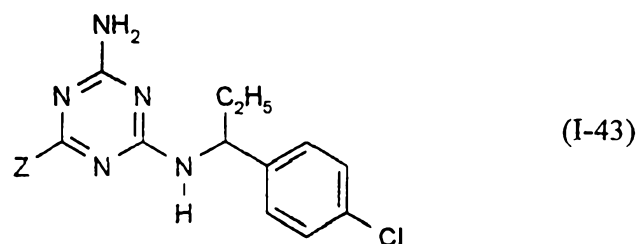
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 41

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

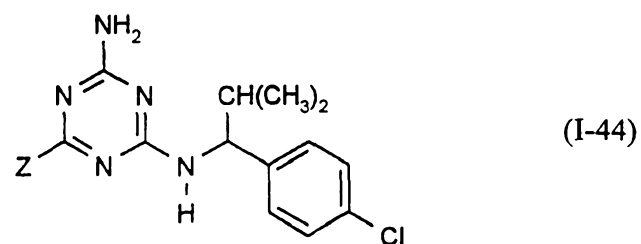
5 Gruppe 42

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 43

10

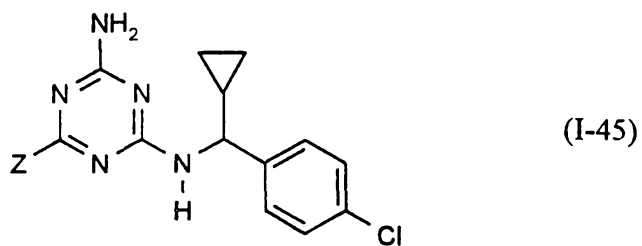
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 44

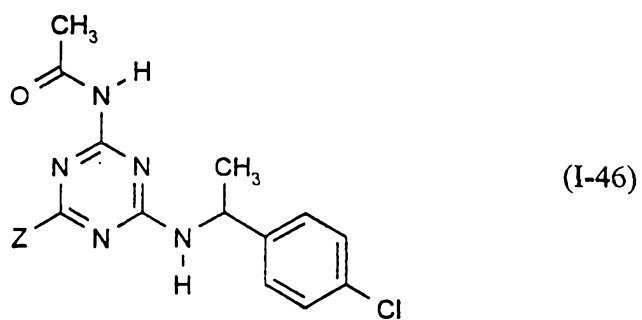
15

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

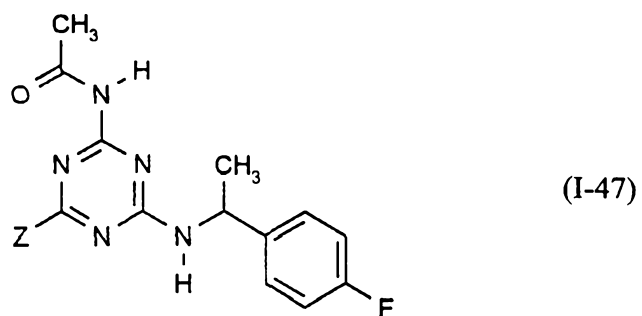


Gruppe 45

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

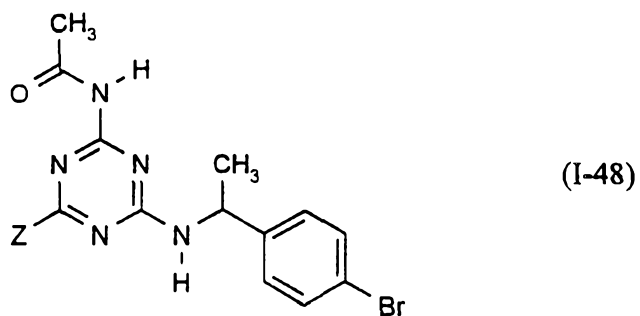
5 Gruppe 46

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

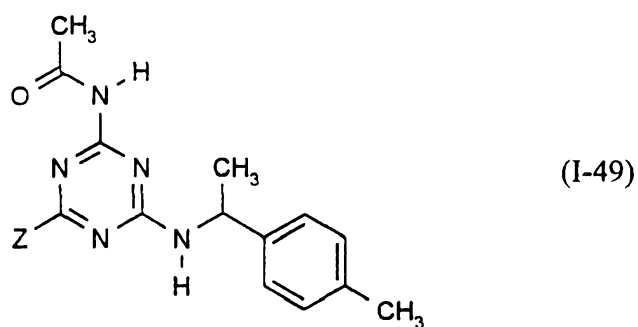
Gruppe 47

10

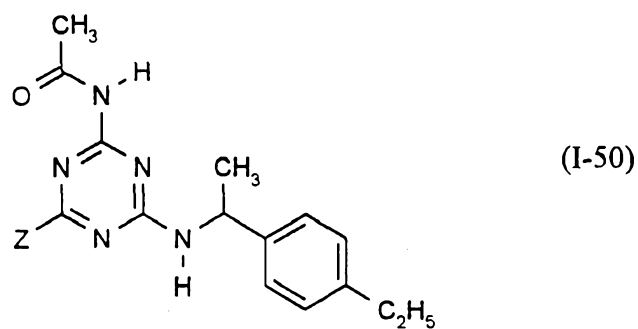
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 48

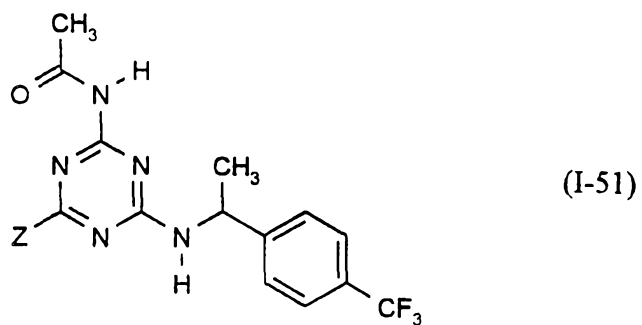
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 49

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

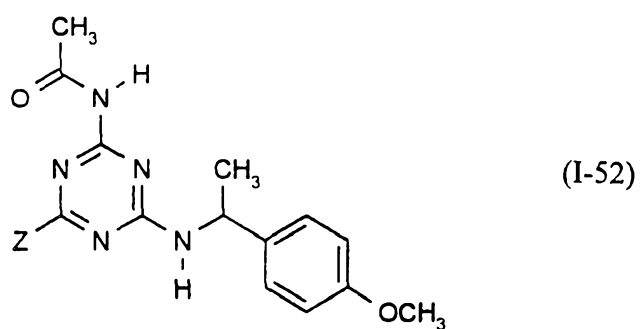
Gruppe 50

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

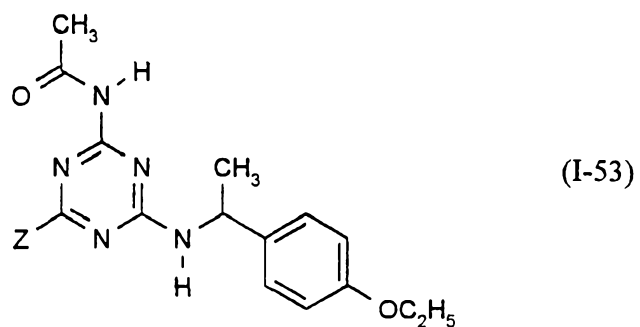
Gruppe 51

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

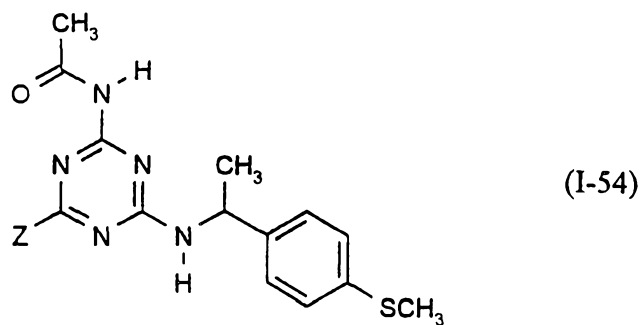
Gruppe 52

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

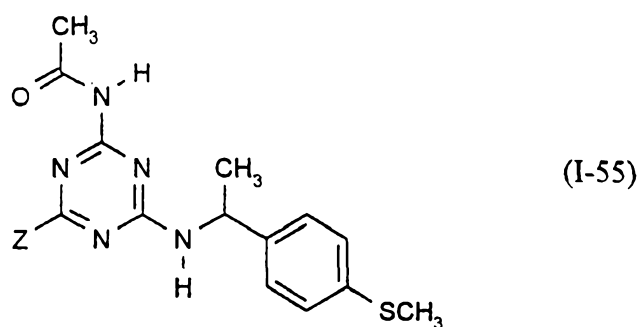
Gruppe 53

10

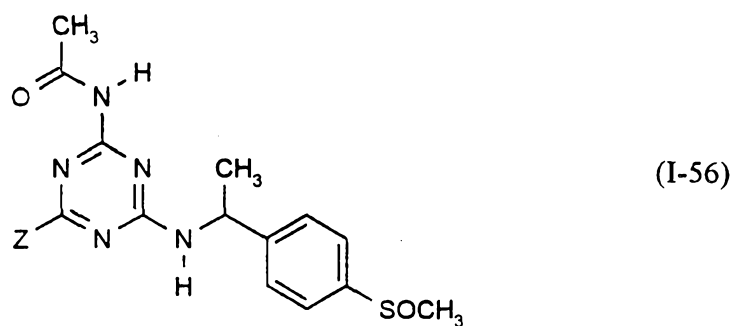
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 54

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

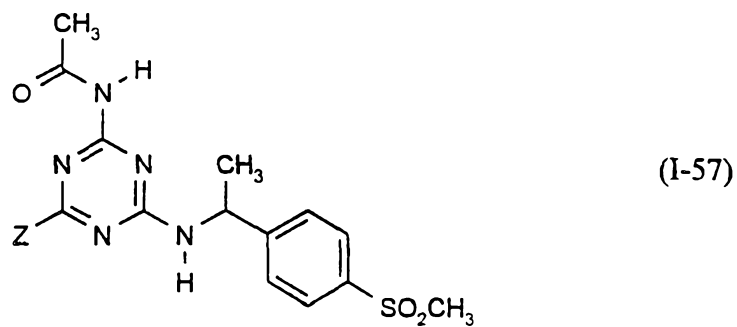
5 Gruppe 55

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

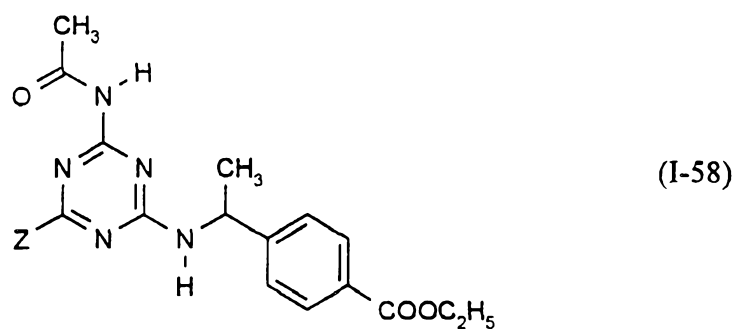
Gruppe 56

10

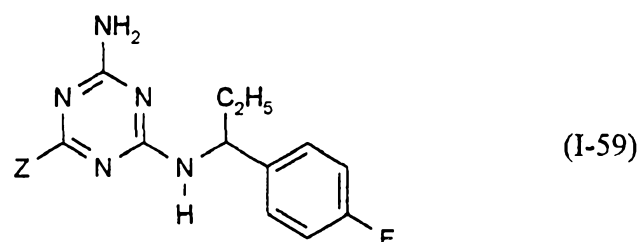
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 57

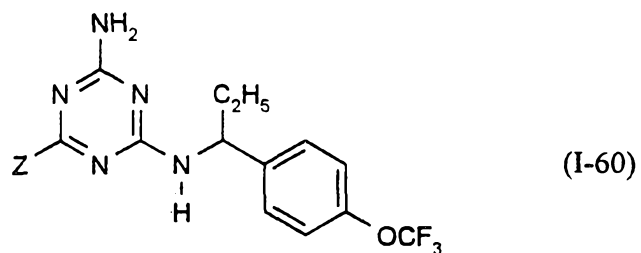
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 58

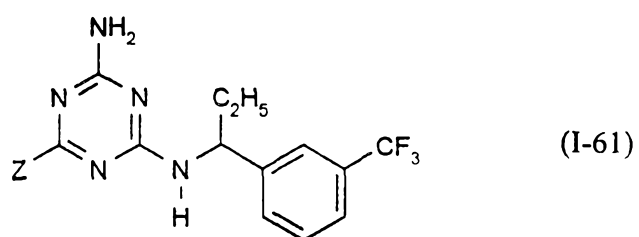
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 59

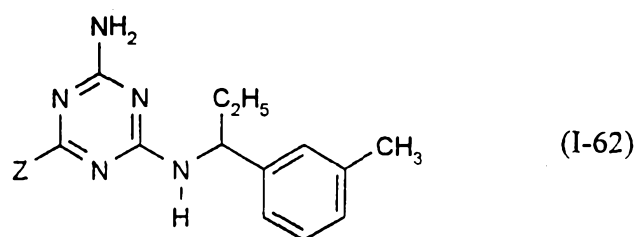
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 60

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

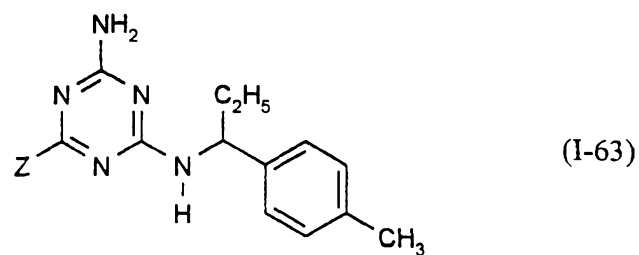
5 Gruppe 61

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 62

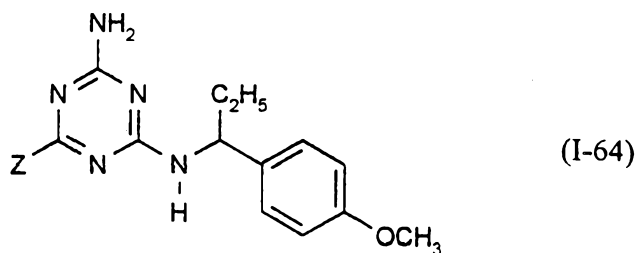
10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 63

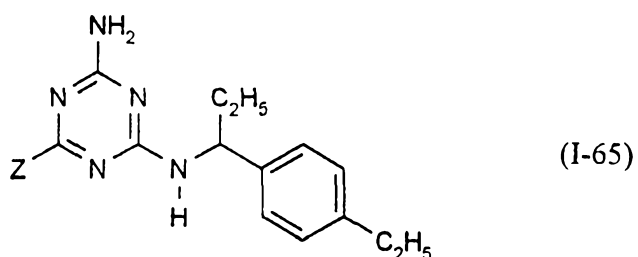
15

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 64

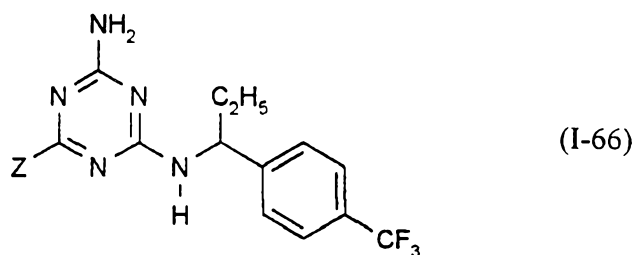
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

Gruppe 65

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

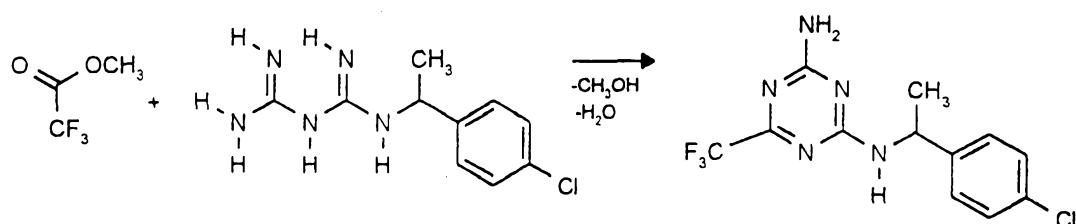
10

Gruppe 66

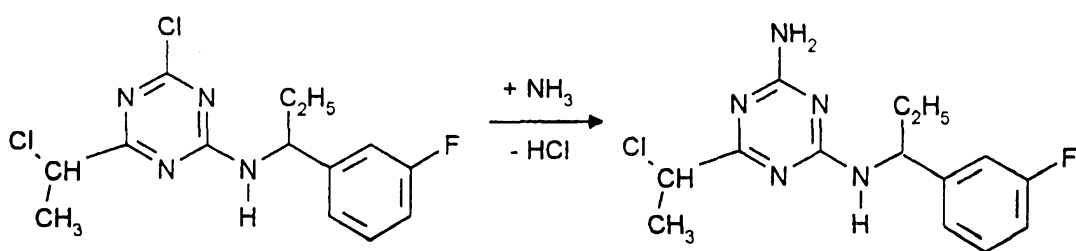
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Verwendet man beispielsweise 1-[1-(4-Chlor-phenyl)-ethyl]biguanid und Trifluor-essigsäuremethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

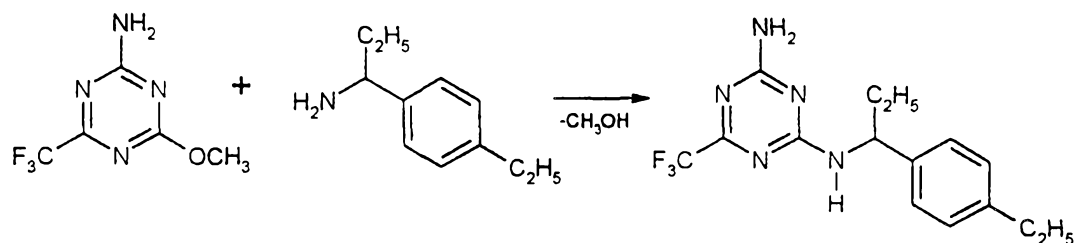
15



Verwendet man beispielsweise 2-Chlor-4-[1-(3-fluor-phenyl)-propylamino]-6-(1-chlor-ethyl)-1,3,5-triazin und Ammoniak als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

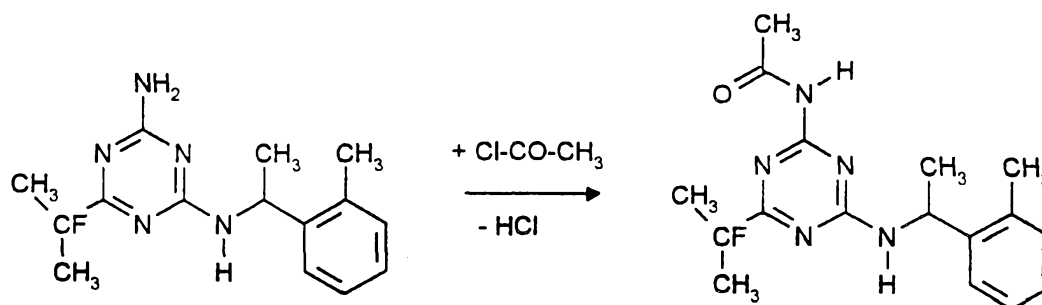


Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin und 1-(4-Ethyl-phenyl)-propylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-(1-fluor-1-methyl-ethyl)-6-[1-(2-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin und Acetylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) durch das folgende Formelschema skizziert werden:





Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Biguanide sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und X vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  bzw. X angegeben wurden.

Als Beispiele für die substituierten Biguanide der Formel (II) - wobei jeweils die Racemate, die R-Enantiomeren und die S-Enantiomeren bevorzugt sind - seien genannt:

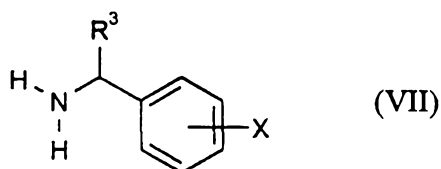
1-(1-(2-Fluor-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(3-Fluor-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Fluor-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Chlor-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(3-Chlor-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Chlor-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Brom-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(3-Brom-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Brom-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Nitro-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(3-Nitro-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Nitro-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Methyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(3-Methyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Methyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Trifluormethyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(3-Trifluormethyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Trifluormethyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Methoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(3-Methoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Methoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Difluormethoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Difluormethoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Difluormethoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Trifluormethoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(3-Trifluormethoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Trifluormethoxy-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Methoxycarbonyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Ethoxycarbonyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Methoxycarbonyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Ethoxycarbonyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Methylthio-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Methylthio-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-Methylsulfinyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(4-Methylsulfinyl-phenyl)-ethyl)-, 1-(1-(2-

Methylsulfonyl-phenyl)-ethyl)- und 1-(1-(4-Methylsulfonyl-phenyl)-ethyl)-biguanid.

Geeignete Säureaddukte von Verbindungen der Formel (II) sind deren Additionsprodukte mit Protonensäuren, wie z.B. mit Chlorwasserstoff (Hydrogenchlorid), Bromwasserstoff (Hydrogenbromid), Schwefelsäure, Methansulfonsäure, Benzolsulfonsäure und p-Toluolsulfonsäure.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind mit Ausnahme von 1-[1-(4-Trifluormethyl-phenyl)-ethyl]-biguanid (vgl. US 3860648) noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind unter Ausnahme von 1-[1-(4-Trifluormethyl-phenyl)-ethyl]-biguanid als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Man erhält die substituierten Biguanide der allgemeinen Formel (II), wenn man substituierte Phenylalkylamine der allgemeinen Formel (VII)

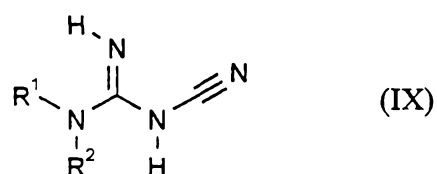


in welcher

$R^3$  und X die oben angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (VII), wie z.B. die Hydrochloride -

mit Cyanoguanidinen der allgemeinen Formel (IX)



in welcher

5  $\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. Hydrogenchlorid, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. n-Decan oder 1,2-Dichlor-benzol, bei Temperaturen zwischen 100°C und 200°C umgesetzt (vgl. US 10 3860648, Herstellungsbeispiele).

Die hierfür als Vorprodukte benötigten substituierten Phenylalkylamine der Formel (VII) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE 2442845; DE 4038356; EP 490175; US 5300437; J. Am. Chem. Soc. 105 (1983), 1578-1584; Tetrahedron: Asymmetry 4 (1993), 2095-2100; Bio-technol. Tech. 10 (1996), 335-338 - zit. in Chem. Abstracts 125: 58008).

Die Cyanoguanidine der Formel (IX) sind bekannte Syntheschemikalien.

20 Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkoxycarbonylverbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) hat Z vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für Z angegeben wurde;  $\text{R}'$  steht vorzugsweise für 25 Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind bekannte Syntheschemikalien.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Aminotriazine sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der Formel (IV) haben  $R^3$ , X und Z vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^3$ , X und Z angegeben wurden;  $X^1$  steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy, insbesondere für Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy.

5

10

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (IV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP 300313).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Stickstoffverbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der Formel (V) haben  $R^1$  und  $R^2$  vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^1$  und  $R^2$  angegeben wurden.

15

20

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (V) sind bekannte Syntheschemikalien.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Aminotriazine sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In der Formel (VI) haben  $R^1$ ,  $R^2$  und Z vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^1$ ,  $R^2$  und Z angegeben wurden;  $X^2$  steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy, insbesondere für Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy.

25

30

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. WO 95/11237).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Aminoverbindungen sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In der Formel (VII) haben  $R^3$  und X vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^3$  und X angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (VII) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE 2442845; DE 4038356; EP 490175; US 5300437; J. Am. Chem. Soc. 105 (1983), 1578-1584; Tetrahedron: Asymmetry 4 (1993), 2095-2100; Biotechnol. Tech. 10 (1996), 335-338 - zit. in Chem. Abstracts 125: 58008).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden 2,4-Diamino-1,3,5-triazine sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In der Formel (Ia) haben  $R^1$ ,  $R^3$ , X und Z vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^1$ ,  $R^3$ , X und Z angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (Ia) sind als neue Verbindungen auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung; sie können gemäß den erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) oder (c) hergestellt werden.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkylierungs-, Acylierungs- oder Sulfonylierungsmittel sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In der Formel (VIII) hat  $R^2$  vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^2$  angegeben wurde; Y steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methoxy, Ethoxy, Methoxysulfonyloxy, Ethoxysulfonyloxy, Acetyloxy oder Propionyloxy.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (VIII) sind bekannte Syntheschemikalien.

Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) werden gegebenenfalls unter Verwendung eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als Reaktionshilfsmittel für die Verfahren (a), (b), (c) und (d) kommen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium- -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) kommen gegebenenfalls inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Methyl-isopropyl-ke-ton oder Methyl-isobutyl-ke-ton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid;

Ester wie Essigsäuremethylester, -ethylester, -n- oder -i-propylester, -n-, -i- oder -s-butylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, s- oder t-Butanol, Ethylenglykol-monomethylether, Ethylenglykol-monoethylether, Diethylenglykol-monomethylether, Diethylenglykol-monoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 300°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 250°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera, Phalaris.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.



Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) eignen sich insbesondere zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

- 5 Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.
- 10 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln.
- 15 Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe,
- 20 wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfractionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.
- 25 Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor,
- 30 Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren,

wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkyl-arylpolyglykoether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

5

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

10

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

25

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Asulam, Atrazine, Azimsulfuron, Benazolin, Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butylate, Cafenstrole, Carbetamide, Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cinmethylin, Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clopyralid, Clopyrasulfuron, Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim,

30

Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclo-  
 fop(-methyl), Difenzoquat, Diflufenican, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Di-  
 methametryn, Dimethenamid, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron,  
 Dymron, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-methyl), Ethofumesate,  
 5 Ethoxyfen, Etobenzanid, Fenoxaprop(-ethyl), Flamprop(-isopropyl), Flamprop(-iso-  
 propyl-L), Flamprop(-methyl), Flazasulfuron, Fluazifop(-butyl), Flumetsulam, Flumi-  
 clorac(-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoro-  
 glycofen(-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurenol, Fluridone, Fluroxypyr, Flur-  
 primidol, Flurtamone, Fomesafen, Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-isopropyl-  
 10 ammonium), Halosafen, Haloxyfop(-ethoxyethyl), Hexazinone, Imazamethabenz(-  
 methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazo-  
 sulfuron, Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isoxaben, Isoxaflutole, Isoxapyrifop,  
 Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Metamitron, Metazachlor,  
 Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, Metolachlor, Metosulam, Met-  
 15 oxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide,  
 Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiazon,  
 Oxyfluorfen, Paraquat, Pendimethalin, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor,  
 Primisulfuron(-methyl), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propyz-  
 amide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen,  
 20 Pyributicarb, Pyridate, Pyrithiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quizalofop(-  
 ethyl), Quizalofop(-p-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulco-  
 trione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl), Sulfosate, Tebutam, Tebuthiuron, Ter-  
 buthylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifen-  
 sulfuron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron,  
 25 Tribenuron(-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin und Triflusulfuron.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden,  
 Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennähr-  
 stoffen und Bodenstruktur-verbesserungsmitteln ist möglich.

30

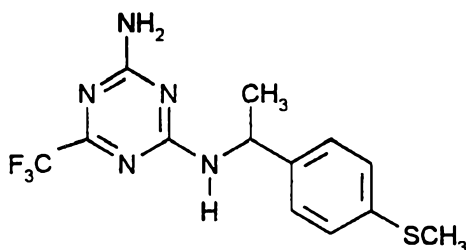
Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus  
 durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige  
 Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt

werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

10 Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

15 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:Beispiel 1

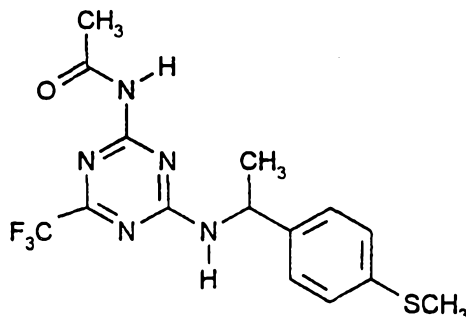
5

## (Verfahren (a))

10 Eine Lösung von 4,6 g (85 mMol) Natriummethylat in 15 ml Methanol wird tropfenweise unter Rühren bei 20°C bis 35°C zu einer Mischung aus 20,4 g (80 mMol) 1-[1-(4-Methylthio-phenyl)-ethyl]-biguanid (racemisch), 13 g (80 mMol) Trifluoressigsäureethylester und 100 ml Methanol gegeben und die Reaktionsmischung wird dann noch 15 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Dann wird mit Methylenchlorid und Wasser geschüttelt, die organische Phase abgetrennt, mit 1%iger Natronlauge gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im

15 Wasserstrahlvakuum sorgfältig eingeeengt, der Rückstand durch Digerieren mit Ligroin zur Kristallisation gebracht und das Produkt durch Absaugen isoliert.

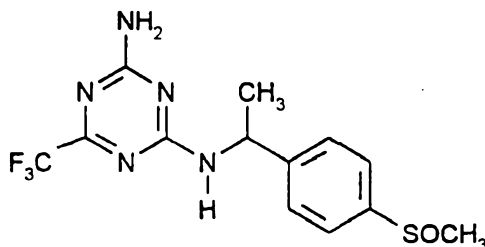
20 Man erhält 12,4 g (47% der Theorie) 2-Amino-4-trifluormethyl-6-[1-(4-methylthiophenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin (Racemat) vom Schmelzpunkt 111°C.

Beispiel 2

5 (Verfahren (d))

10 Eine Mischung aus 16,5 g (50 mMol) 2-Amino-4-trifluormethyl-6-[1-(4-methylthio-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin (racemisch) und 60 ml Acetanhydrid wird 3 Stunden bei 130°C gerührt, nach Abkühlen auf Raumtemperatur (ca. 20°C) mit 200 ml Wasser versetzt und eine weitere Stunde bei Raumtemperatur gerührt. Dann wird das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

15 Man erhält 13,3 g (72% der Theorie) 2-Acetyl-4-trifluormethyl-6-[1-(4-methylthio-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin (Racemat) vom Schmelzpunkt 132°C.

Beispiel 3

20 (Folgeumsetzung)

5 g 3-Chlor-perbenzoesäure (ca. 60%ig) werden innerhalb von 30 Minuten unter Rühren zu einer Mischung aus 6,6 g (20 mMol) 2-Amino-4-trifluormethyl-6-[1-(4-

methythio-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin (racemisch) und 80 ml Dichlormethan gegeben und die Reaktionsmischung wird dann noch eine Stunde bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Anschließend wird mit Wasser und dann mit 5%iger wässriger Ammoniaklösung gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum sorgfältig abdestilliert.

Man erhält 4,4 g (64% der Theorie) 2-Amino-4-trifluormethyl-6-[1-(4-methylsulfinyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin (Racemat) als festes Produkt vom Schmelzpunkt 220°C (Zersetzung).

Analog zu den Herstellungsbeispielen 1 bis 3 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) hergestellt werden.

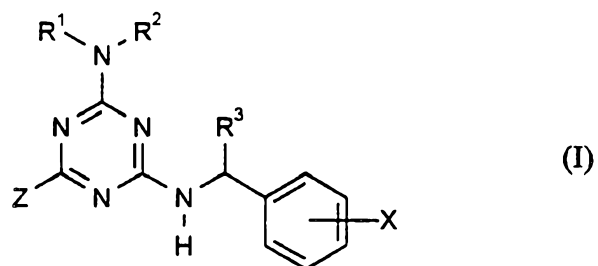


Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

5

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
4	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	Cl	Fp.: 133°C (R-Enantiomer)
5	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	Cl	Fp.: 133°C (S-Enantiomer)
6	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	Cl	(amorph) (R-Enantiomer)
7	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	Cl	(amorph) (S-Enantiomer)
8	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	Cl	Fp.: 193°C (Racemat)
9	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	Cl	(amorph) (Racemat)
10	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	SCH <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
11	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	SCH <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
12	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	SCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)



**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
13	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer) $[\alpha]_D^{20} = -133.54$
14	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer) $[\alpha]_D^{20} = +129.84$
15	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	Fp.: 119°C (S-Enantiomer) $[\alpha]_D^{20} = -175.39$
16	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (S-Enantiomer) $[\alpha]_D^{20} = -100.61$
17	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer) $[\alpha]_D^{20} = -121.76$
18	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	Fp.: 116°C (S-Enantiomer) $[\alpha]_D^{20} = -156.85$
19	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (S-Enantiomer) $[\alpha]_D^{20} = -117.31$

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
20	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 140°C (S-Enantiomer) [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> = -193.46
21	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	Fp.: 119°C (R-Enantiomer) [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> = + 169.03
22	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (R-Enantiomer) [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> = +107.30
23	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer) [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> = +18.77
24	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 230°C (Racemat)
25	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 162°C (Racemat)
26	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 235°C (Racemat)
27	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
28	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
29	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
30	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Fp.: 170°C (Racemat)
31	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Fp.: 193°C (Racemat)
32	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Fp.: 205°C (Racemat)
33	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
34	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
35	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
36	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	Fp.: 121°C (Racemat)
37	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	Fp.: 193°C (Racemat)
38	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	Fp.: 212°C (Racemat)
39	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 80°C (Racemat)
40	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 215°C (Racemat)
41	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 170°C (Racemat)
42	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 102°C (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
43	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 192°C (Racemat)
44	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 195°C (Racemat)
45	H	H	CH <sub>3</sub>	(3-) Br	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 136°C (Racemat)
46	H	H	CH <sub>3</sub>	(3-) CF <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 137°C (Racemat)
47	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 106°C (Racemat)
48	H	H	CH <sub>3</sub>	(3-) CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>20</sup> <sub>D</sub> = 1.5440 (Racemat)
49	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 160°C (Racemat)
50	H	H	CH <sub>3</sub>	(2-) CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Fp.: 117°C (Racemat)
51	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	OH	Fp.: >240°C (Racemat)
52	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
53	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
54	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	(S-Enantiomer)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
55	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
56	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
57	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	(S-Enantiomer)
58	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R-Enantiomer)
59	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R-Enantiomer)
60	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(S-Enantiomer)
61	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF <sub>3</sub>	(Racemat)
62	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
63	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF <sub>3</sub>	(S-Enantiomer)
64	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF <sub>3</sub>	(Racemat)
65	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
66	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF <sub>3</sub>	(S-Enantiomer)
67	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
68	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R-Enantiomer)
69	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(S-Enantiomer)
70	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(Racemat)
71	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R-Enantiomer)
72	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(S-Enantiomer)
73	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CHFCH <sub>3</sub>	(Racemat)
74	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CHFCH <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
75	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CHFCH <sub>3</sub>	(S-Enantiomer)
76	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CHFCH <sub>3</sub>	(Racemat)
77	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CHFCH <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
78	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) F	CHFCH <sub>3</sub>	(S-Enantiomer)
79	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
80	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
81	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 111°C (S-Enantiomer)
82	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 130°C (Racemat)
83	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 105°C (R-Enantiomer)
84	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 108°C (S-Enantiomer)
85	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	Fp.: 145°C (Racemat)
86	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
87	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
88	H	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	Fp.: 128°C (Racemat)
89	H	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	Fp.: 108°C (R-Enantiomer)
90	H	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	Fp.: 116°C (S-Enantiomer)
91	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorph) (Racemat)
92	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	(amorph) (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp. - Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
93	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHFCF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
94	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHCl <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
95	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 149°C (Racemat)
96	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHClCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
97	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
98	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 149°C (Racemat)
99	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	Fp.: 99°C (Racemat)
100	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 113°C (Racemat)
101	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
102	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 177°C (Racemat)
103	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 141°C (Racemat)
104	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 182°C (Racemat)



**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
105	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 185°C (Racemat)
106	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	OH	Fp.: >250°C (Racemat)
107	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	Fp.: >250°C (Racemat)
108	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 125°C (Racemat)
109	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 161°C (Racemat)
110	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
111	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 134°C (Racemat)
112	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 187°C (Racemat)
113	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 221°C (Racemat)
114	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 109°C (Racemat)
115	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	(amorph) (Racemat)
116	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	(amorph) (Racemat)
117	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 139°C (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp. - Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
118	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 151°C (Racemat)
119	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 172°C (Racemat)
120	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 103°C (Racemat)
121	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 214°C (Racemat)
122	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 145°C (Racemat)
123	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 111°C (Racemat)
124	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 155°C (Racemat)
125	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 179°C (Racemat)
126	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Fp.: 133°C (Racemat)
127	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
128	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
129	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Fp.: 114°C (Racemat)
130	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Fp.: 255°C (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
131	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Fp.: 185°C (Racemat)
132	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	(amorph) (Racemat)
133	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	Fp.: 153°C (Racemat)
134	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	(amorph) (Racemat)
135	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SCH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	Fp.: 124°C (Racemat)
136	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	Fp.: 185°C (Racemat)
137	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) SOCH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	Fp.: 210°C (Racemat)
138	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Fp.: 130°C (Racemat)
139	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	OH	Fp. >260°C (Racemat)
140	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Fp.: 163°C (Racemat)
141	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Fp.: 185°C (Racemat)
142	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHFCF <sub>3</sub>	Fp.: 165°C (Racemat)
143	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 187°C (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
144	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 153°C (Racemat)
145	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 132°C (Racemat)
146	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 126°C (Racemat)
147	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Fp.: 159°C (Racemat)
148	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	OH	Fp. >240°C (Racemat)
149	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 152°C (R-Enantiomer)
150	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 126°C (R-Enantiomer)
151	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> Cl	(amorph) (R-Enantiomer)
152	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 153°C (R-Enantiomer)
153	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
154	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Fp.: 155°C (R-Enantiomer)
155	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHFCF <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
156	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHFCF <sub>3</sub>	Fp.: 154°C (R-Enantiomer)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
157	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHClCH <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
158	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 119°C (R-Enantiomer)
159	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
160	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CCl <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Fp.: 118°C (R-Enantiomer)
161	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
162	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 132°C (R-Enantiomer)
163	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Fp.: 110°C (R-Enantiomer)
164	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	OH	Fp. >240°C (R-Enantiomer)
165	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	OH	Fp. >240°C (R-Enantiomer)
166	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
167	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
168	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 133°C (S-Enantiomer)
169	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 138°C (S-Enantiomer)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
170	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
171	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHClCH <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
172	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	OH	Fp. >240°C (S-Enantiomer)
173	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Fp.: 182°C (S-Enantiomer)
174	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHFCH <sub>3</sub>	Fp.: 175°C (S-Enantiomer)
175	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHCl <sub>2</sub>	Fp.: 131°C (S-Enantiomer)
176	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> Cl	Fp.: 126°C (S-Enantiomer)
177	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHClCH <sub>3</sub>	Fp.: 110°C (S-Enantiomer)
178	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Fp.: 155°C (S-Enantiomer)
179	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	H	Fp.: 178°C (Racemat)
180	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
181	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH=CH <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)



Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
182	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n	(amorph) (Racemat)
183	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	H	Fp.: 198°C (Racemat)
184	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>3</sub>	Fp.: 155°C (Racemat)
185	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH=CH <sub>2</sub>	Fp.: 142°C (Racemat)
186	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n	Fp.: 153°C (Racemat)
187	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	Fp.: 136°C (Racemat)
188	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> -n	(amorph) (Racemat)
189	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> -n	Fp.: 122°C (Racemat)
190	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
191	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CF <sub>3</sub>	Fp.: 139°C (Racemat)
192	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>3</sub>	Fp.: 144°C (R-Enantiomer)
193	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHBrCH <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
194	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
195	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
196	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	H	(amorph) (R-Enantiomer)
197	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
198	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	CHBrCH <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
199	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 156°C (Racemat)
200	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	Fp.: 62°C (Racemat)
201	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-)Cl	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
202	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-)Cl	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
203	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-)Cl	H	Fp.: 100°C (Z.) (Racemat)
204	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-)Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorph) (Racemat)
205	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-)Cl	CHClCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
206	H	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-)Cl	CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
207	H	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-)Cl	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)



**Tabelle 1** (Fortsetzung)

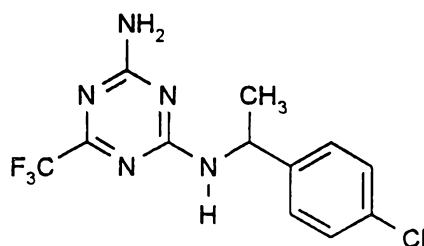
Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
208	H	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-)Cl	H	Fp.: 179°C (Racemat)
209	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
210	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	CH <sub>2</sub> - CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
211	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl		(amorph) (Racemat)
212	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	C <sub>9</sub> H <sub>19</sub>	(amorph) (Racemat)
213	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	CHBrCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
214	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
215	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	$\text{CH}_2\text{SCH}_3$ $\parallel$ O	Fp.: 182°C (Racemat)
216	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Fp.: 137°C (Racemat)
217	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	$\begin{array}{c} \text{CHCH}_3 \\   \\ \text{OH} \end{array}$	(amorph) (Racemat)
218	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	$\begin{array}{c} \text{CHCH}_3 \\   \\ \text{OH} \end{array}$	(amorph) (S-Enantiomer)
219	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl		Fp.: 186°C (Racemat)
220	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Fp.: 148°C (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
221	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	C <sub>9</sub> H <sub>19</sub>	Fp.: 103°C (Racemat)
222	H	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-)Cl	CHBrCH <sub>3</sub>	Fp.: 118°C (Racemat)

„Z.“ = Zersetzung

Die in Tabelle 1 als Beispiel 99 aufgeführte Verbindung kann beispielsweise auch wie folgt hergestellt werden:



(Verfahren (c))

Eine Mischung aus 2,0 g (12 mMol) 1-(4-Chlor-phenyl)-ethyamin (racemisch) und 1,0 g (5,2 mMol) 2-Amino-4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin wird 3 Stunden unter Argon auf 170°C erhitzt. Nach dem Abkühlen wird in Methylenchlorid aufgenommen und mit 1N-Salzsäure angesäuert. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt und der Rückstand säulenchromatographisch (Kieselgel, Essigsäureethylester) gereinigt.

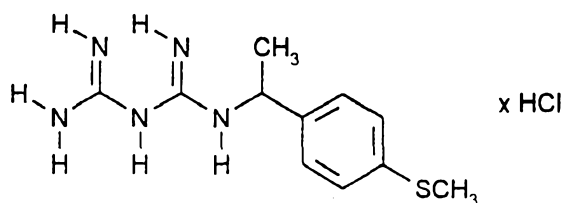
- 65 -

Man erhält 1,29 g (79% der Theorie) 2-Amino-4-(1-(4-chlor-phenyl)-ethylamino)-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin (Racemat) vom Schmelzpunkt 99°C.

Ausgangsstoffe der Formel (II):

5

Beispiel (II-1)



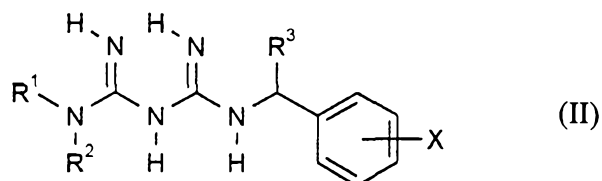
10 Eine Mischung aus 17 g (84 mMol) 1-(4-Methylthio-phenyl)-ethylamin-Hydrochlorid (racemisch), 8 g (95 mMol) Dicyandiamid (Cyanoguanidin) und 100 ml 1,2-Dichlorbenzol wird 4 Stunden bei 160°C gerührt. Nach Abkühlen wird das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

15 Man erhält 23 g (95% der Theorie) 1-[1-(4-Methylthio-phenyl)-ethyl]-biguanid-Hydrochlorid (Racemat) vom Schmelzpunkt 220°C (Zersetzung).

Die Umsetzung kann bei etwa gleicher Temperatur (140°C bis 160°C) auch ohne Lösungsmittel - d.h. in der Schmelze - durchgeführt werden.

20

Analog Beispiel (II-1) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der Formel (II) bzw. deren Hydrochloride hergestellt werden.



25

Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (II)

- es handelt sich in allen Fällen um die entsprechenden Hydrochloride!

Bsp.-Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Position-) X	Physikal. Daten u. stereochem. Angaben
II-2	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	(Racemat)
II-3	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	(R-Enantiomer)
II-4	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	(S-Enantiomer)
II-5	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) F	(Racemat)
II-6	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	(Racemat)
II-7	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	(Racemat)
II-8	H	H	CH <sub>3</sub>	(4-) CF <sub>3</sub>	(Racemat)
II-9	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) Cl	(Racemat)
II-10	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(4-) Cl	Fp.: 212°C (Racemat)
II-11	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) Br	(Racemat)
II-12	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) F	(Racemat)
II-13	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) CH <sub>3</sub>	(Racemat)
II-14	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) CF <sub>3</sub>	(Racemat)
II-15	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-) OCH <sub>3</sub>	(Racemat)

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

## Pre-emergence-Test

- 5      Lösungsmittel:    5 Gewichtsteile Aceton  
      Emulgator:        1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden mit der Wirkstoffzubereitung begossen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit zweckmäßigerweise konstant. Die Wirkstoffkonzentration in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist nur die Aufwandmenge des Wirkstoffs pro Flächeneinheit.

20      Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

- 0 %        =    keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)  
100 %      =    totale Vernichtung

25

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 13, 14, 16, 22, 142, 149, 155, 156, 157, 159 und 160 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, Weizen und Baumwolle, starke Wirkung gegen Unkräuter (vgl. Tabelle A).

30

„ai.“ = Wirkstoff („active ingredient“).

Beispiel B

## Post-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

20 Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

25 In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 4, 5, 8, 13, 14, 15, 16, 21, 22, 79, 82, 84, 85, 86, 87, 90, 91, 93, 94, 96, 97, 98, 103, 104, 108, 112, 121, 126, 138, 145, 146, 153, 155, 157, 159, 166, 167, 168, 170, 171, 173, 175, 177, 178, 190 und 191 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Weizen und Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter (vgl. Tabelle B).

Tabelle A: Pre-emergence-Test/Gewächshaus

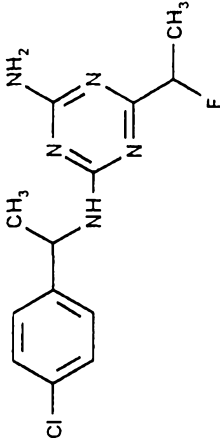
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Alope- curus	Digi- taria	Echino- chloa	Abu- tilon	Datura	Matri- caria
<div></div>	500	0	100	100	100	100	100	100
(14)								

Tabelle A: (Fortsetzung)

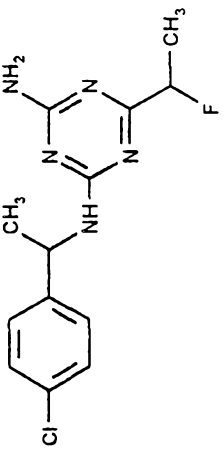
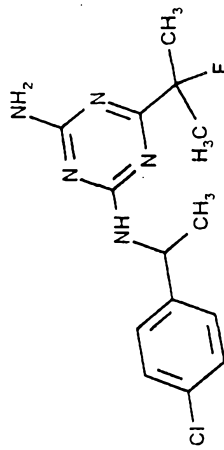
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Abutilon	Amaran- thus	Sinapis
 (13)	1000	0	100	100	100
 (16)	1000	0	80	90	100



Tabelle A: (Fortsetzung)

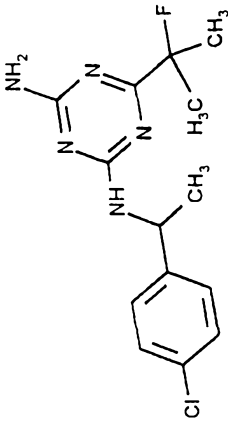
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp. -Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Alope- curus	Setaria	Abutilon	Amaran- thus	Galium	Sinapis
<div></div> <div>(22)</div>	1000	20	100	100	100	100	100	100

Tabelle A: (Fortsetzung)

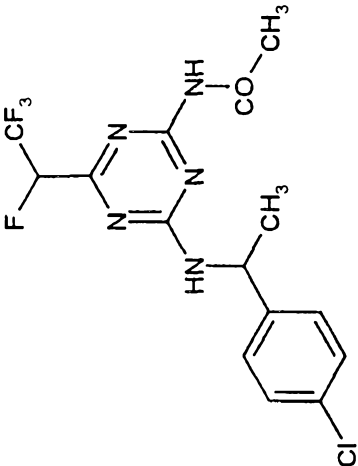
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Baum- wolle	Digi- taria	Echino- chloa	Amaran- thus	Poly- gonum	Vero- nica
 (142)	500	0	0	80	95	100	100	100

Tabelle A: (Fortsetzung)

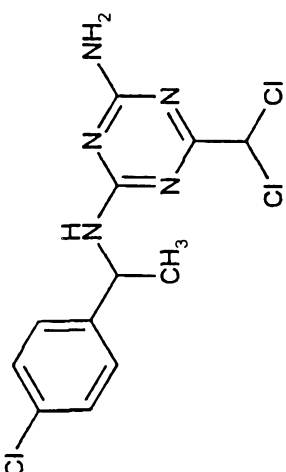
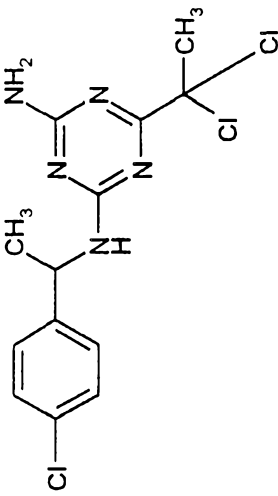
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Baum- wolle	Digi- taria	Echino- chloa	Poly- gonum	Sola- num	Vero- nica
<div></div> (149)	500	0	0	95	100	100	100	100

Tabelle A: (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Baum- wolle	Digi- taria	Echino- chloa	Amaran- thus	Sola- num	Vero- nica
<div></div> <div>(159)</div>	1000	0	0	100	95	100	100	100

- 75 -

Tabelle A: (Fortsetzung)

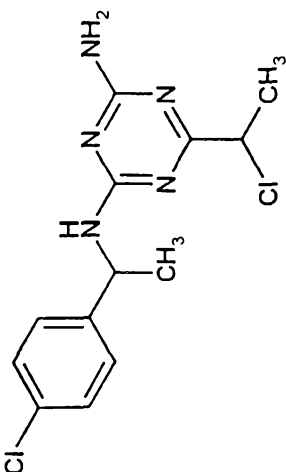
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Baum- wolle	Echino- chloa	Setaria	Poly- gonum	Sola- num	Vero- nica
 (157)	500	0	0	100	95	100	100	100

Tabelle A: (Fortsetzung)

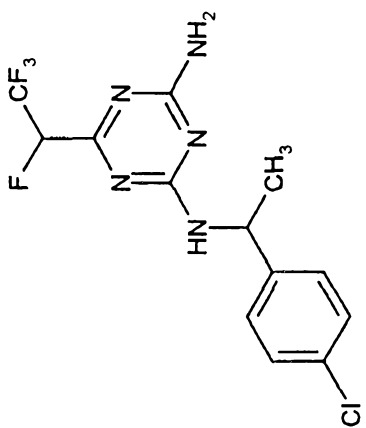
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Digi- taria	Echino- chloa	Se- taria	Amaran- thus	Poly- gonum	Sola- num	Vero- nica
 (155)	1000	0	100	100	100	100	100	100	100

Tabelle A: (Fortsetzung)

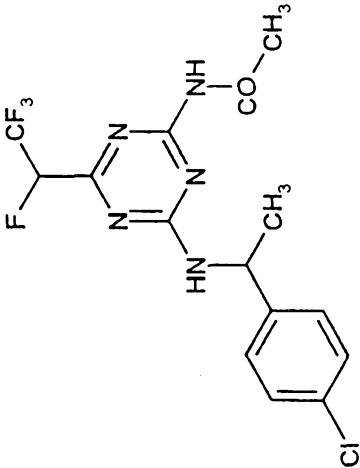
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Digi- taria	Echino- chloa	Se- taria	Amaran- thus	Poly- gonum	Sola- num	Vero- nica
<div></div> <div>(156)</div>	1000	0	100	100	100	100	100	100	100

Tabelle A: (Fortsetzung)

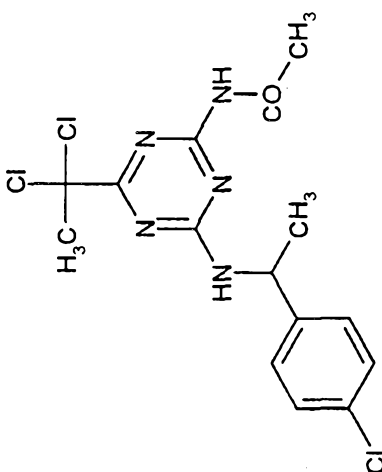
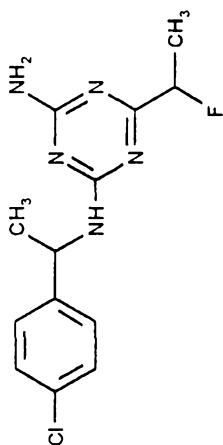
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Digi- taria	Echino- chloa	Se- taria	Amaran- thus	Poly- gonum	Sola- num	Vero- nica
 (160)	1000	0	100	100	95	100	100	100	100



Tabelle B: Post-emergence-Test/Gewächshaus

Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp. -Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Mais	Digitaria	Setaria	Cheno- podium	Datura	Poly- gonum	Viola
--	------------------------------	--------	------	-----------	---------	------------------	--------	----------------	-------



(13)

125

0

10

80

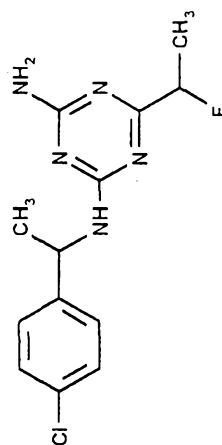
90

100

100

100

100



(14)

125

-

20

-

80

100

100

100

100

Tabelle B: (Fortsetzung)

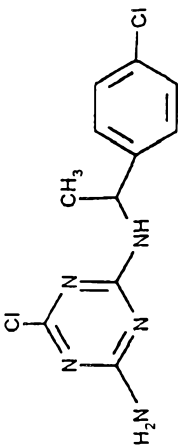
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Alope- curus	Setaria	Ama- ranthus
	1000	20	80	90	100
(4)					

Tabelle B: (Fortsetzung)

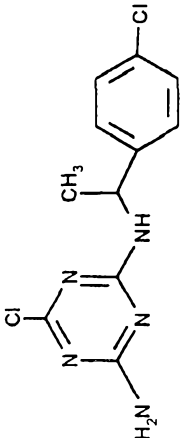
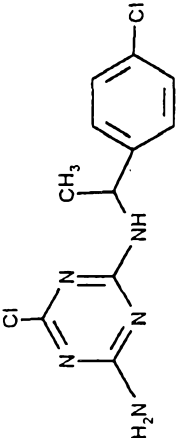
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Alo- pecurus	Avena fatua	Setaria	Abutilon	Ama- ranthus	Sinapis
<div> (5)</div>	1000	100	100	100	100	100	100
<div> (8)</div>	1000	70	80	100	100	100	100

Tabelle B: (Fortsetzung)

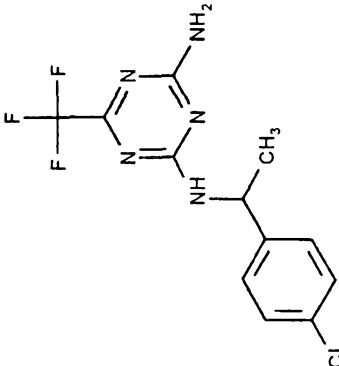
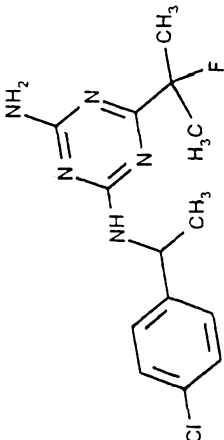
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Alo- pecurus	Avena fatua	Setaria	Abutilon	Ama- ranthus	Sinapis
<div></div> <div>(15)</div>	1000	100	100	100	100	100	100
<div></div> <div>(16)</div>	1000	90	95	100	100	100	100

Tabelle B: (Fortsetzung)

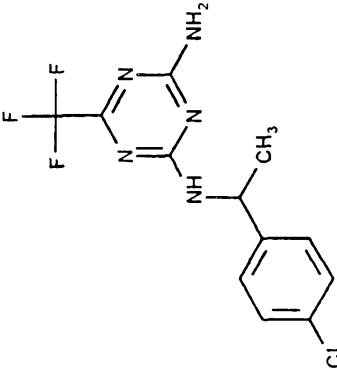
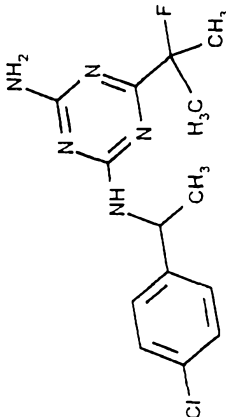
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Avena fatua	Setaria Abutilon	Ama- ranthus	Galium Sinapis	Xanthium
<div></div> <div>(21)</div>	1000	70	100	100	100	100
<div></div> <div>(22)</div>	1000	100	100	100	100	100

Tabelle B: (Fortsetzung)

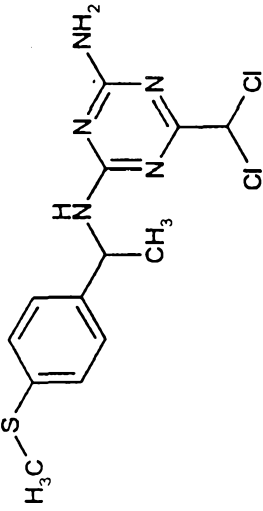
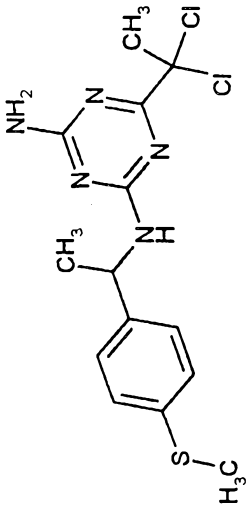
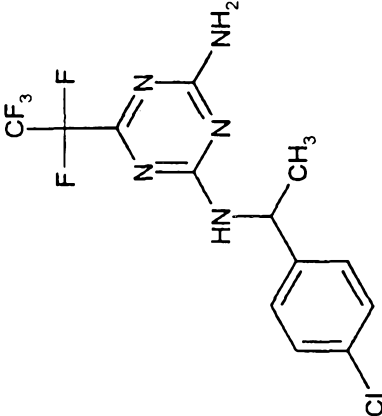
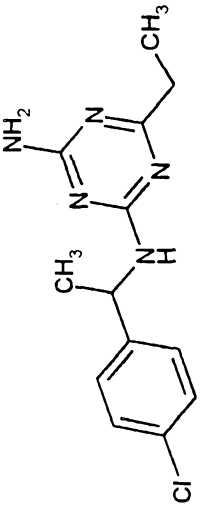
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
	1000	0	90	100	100	80	100
(108)							
	500	0	80	100	100	100	100
(126)							

Tabelle B: (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (138)	250	10	100	100	100	100	100
 (91)	250	10	100	100	100	100	100

- 86 -

Tabelle B: (Fortsetzung)

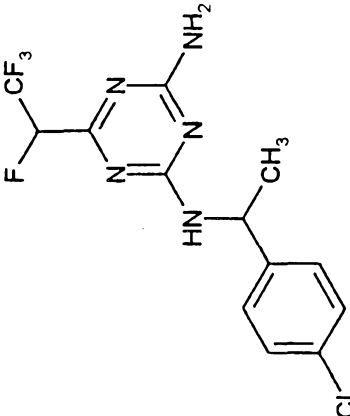
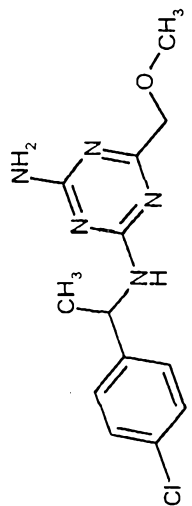
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (93)	250	10	95	100	100	100	100
 (98)	250	10	80	100	100	100	100



Tabelle B: (Fortsetzung)

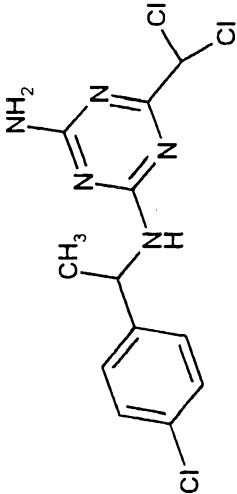
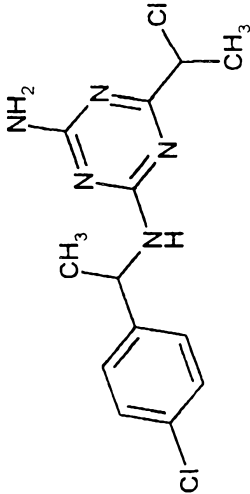
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
	250	10	90	100	100	100	100
(94)							
	250	0	80	100	100	100	100
(96)							

Tabelle B: (Fortsetzung)

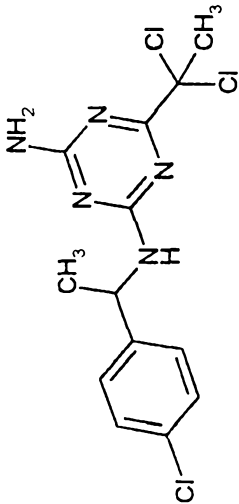
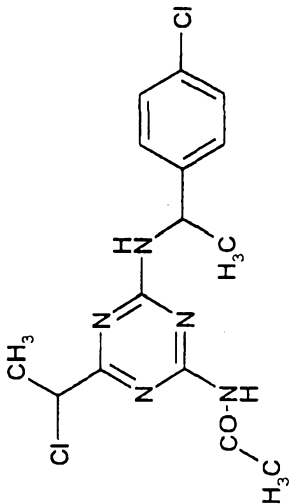
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (97)	250	10	80	100	100	100	100
 (146)	250	10	80	100	100	100	95

Tabelle B: (Fortsetzung)

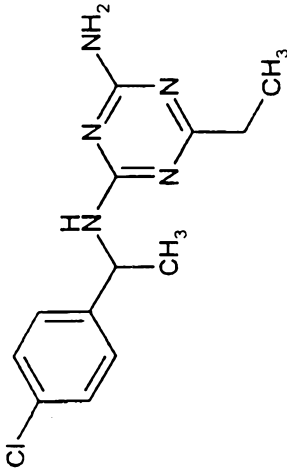
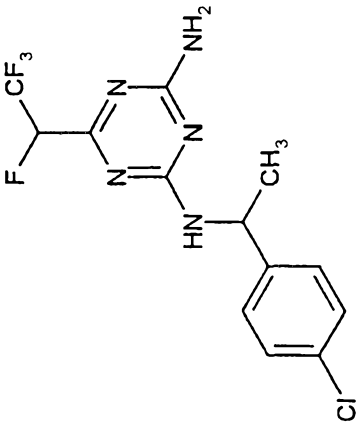
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp. -Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (153)	500	-	95	100	100	100	100
 (155)	250	10	90	100	100	95	95

Tabelle B: (Fortsetzung)

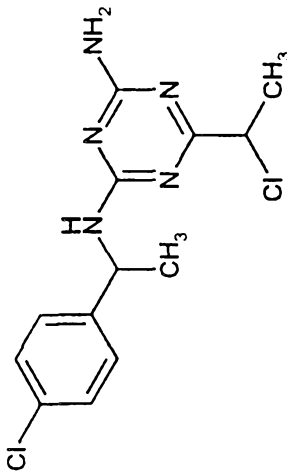
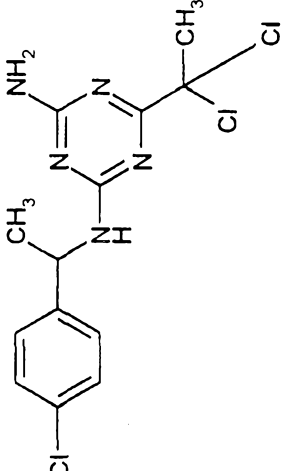
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (157)	250	10	80	100	95	95	95
 (159)	500	10	90	100	100	100	100

Tabelle B: (Fortsetzung)

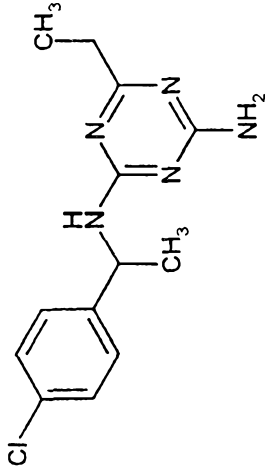
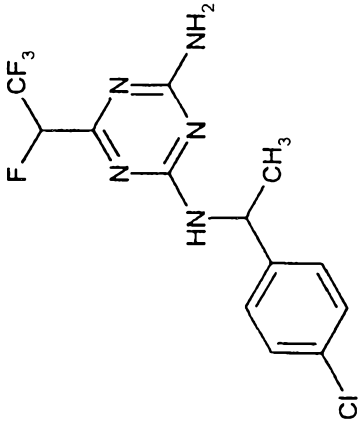
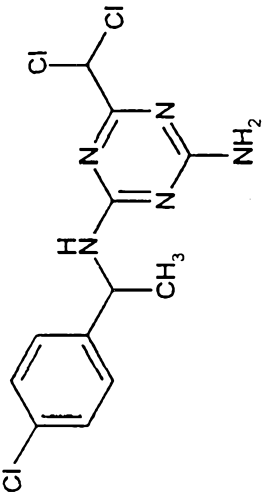
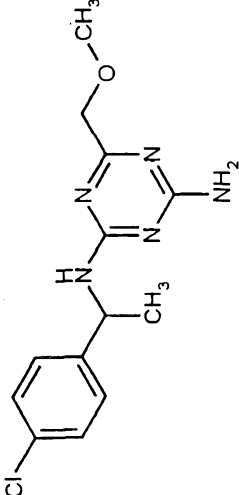
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (166)	500	-	100	100	100	100	100
 (167)	250	10	90	100	100	100	100

Tabelle B: (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (168)	500	10	100	100	100	100	100
 (170)	250	10	-	100	100	100	100

- 93 -

Tabelle B: (Fortsetzung)

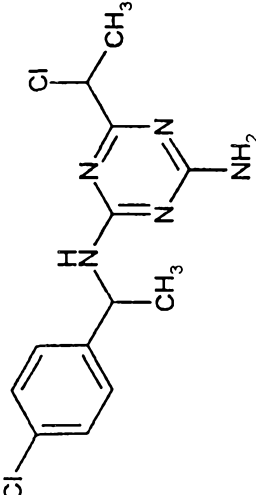
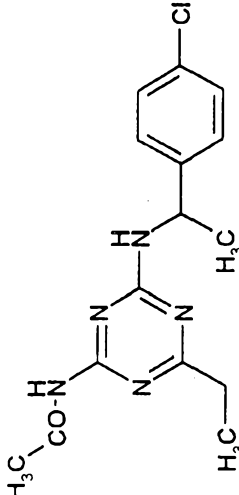
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp. -Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (171)	250	10	90	100	100	100	100
 (173)	500	10	80	100	100	100	100

Tabelle B: (Fortsetzung)

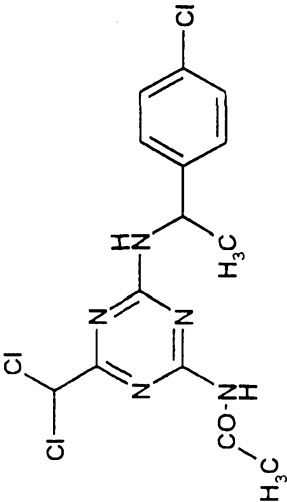
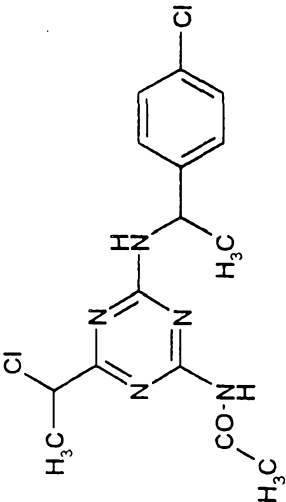
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (175)	500	10	80	100	100	100	100
 (177)	500	10	100	100	100	100	100



Tabelle B: (Fortsetzung)

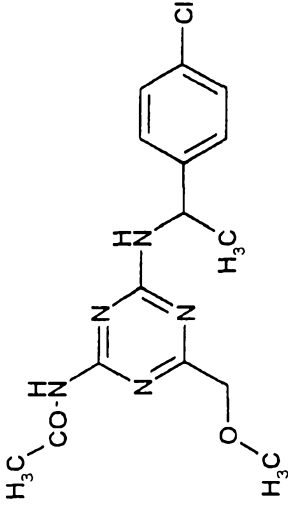
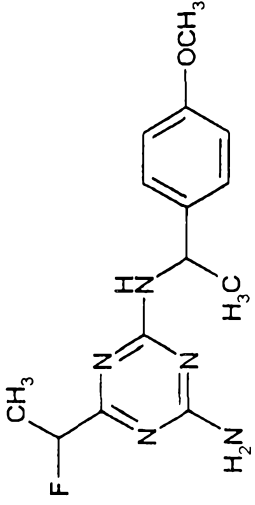
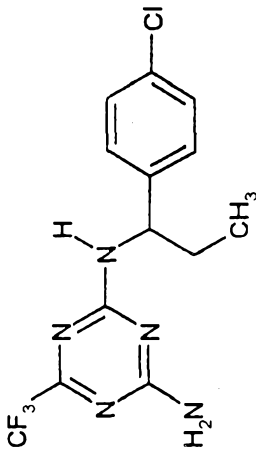
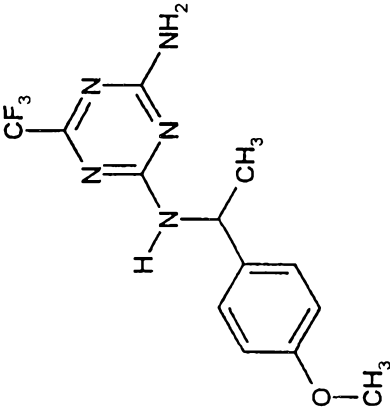
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
<div></div> <div>(178)</div>	500	10	70	100	100	100	100
<div></div> <div>(190)</div>	250	10	-	100	100	100	95

Tabelle B: (Fortsetzung)  
Wirkstoff gemäß  
Herstellungsbsp.-Nr.

	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (85)	250	0	95	100	100	100	100
 (79)	500	0	100	100	100	100	100

- 97 -

Tabelle B: (Fortsetzung)

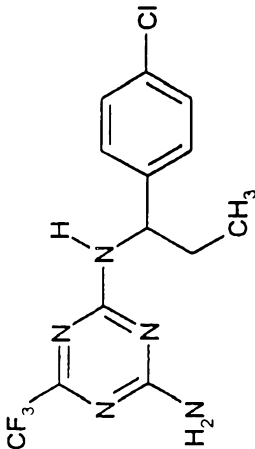
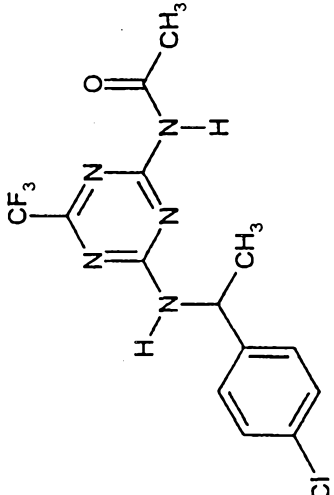
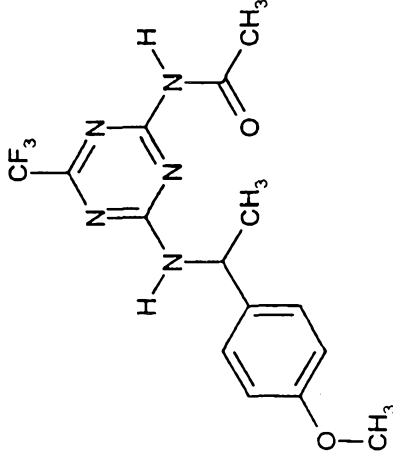
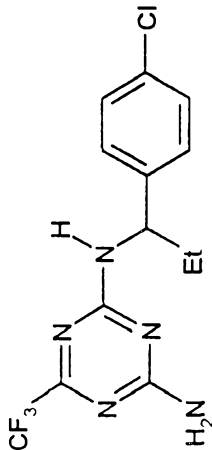
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
 (86)	1000	10	-	100	100	100	100
 (191)	500	10	95	100	100	100	100

Tabelle B: (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Setaria	Ama- ranthus	Cheno- podium	Poly- gonum	Viola
	500	10	95	100	100	100	100

(82)

Tabelle B: (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Setaria	Amaran- thus	Cheno- podium	Stellaria	Viola
<div></div> (87)	250	10	100	100	100	100	100

- 100 -

Tabelle B: (Fortsetzung)

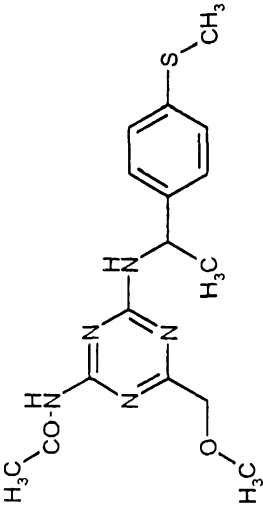
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Setaria	Ama- ranthus	Sinapis
 <chem>COC(=O)c1nc(NC)nc(Cc2ccc(SC)cc2)c1</chem>	1000	0	100	100	100
(103)					

Tabelle B: (Fortsetzung)

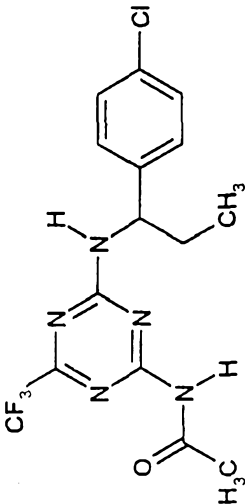
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Setaria	Abutilon	Ama- ranthus	Xanthium
<div></div> (90)	1000	10	100	100	100	90

Tabelle B: (Fortsetzung)

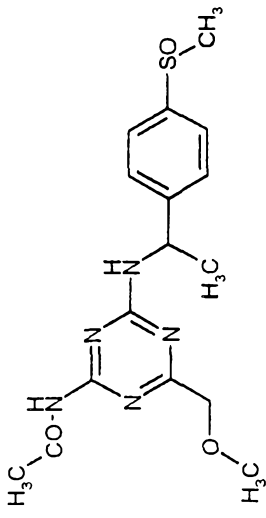
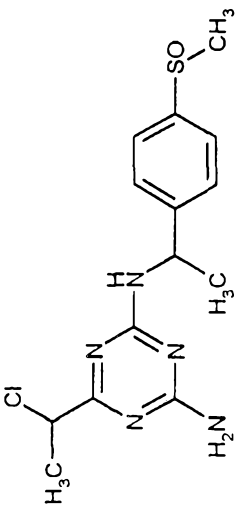
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Setaria	Amaran- thus	Sinapis
	1000	100	100	100
(104)				
	1000	100	100	100
(121)				



Tabelle B: (Fortsetzung)

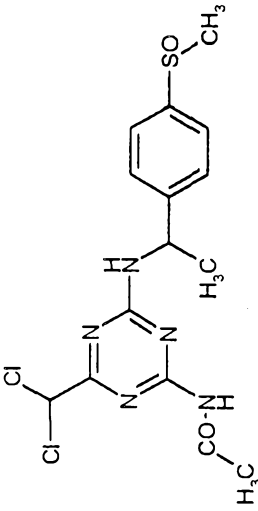
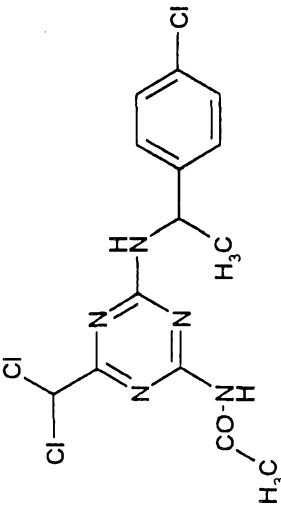
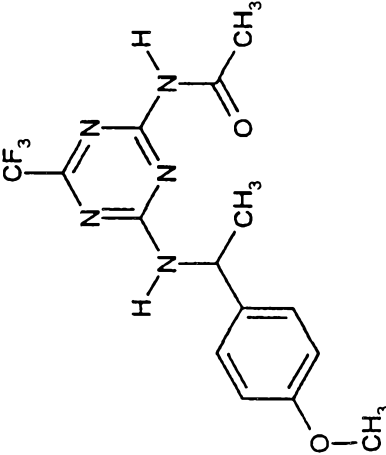
Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Avena fatua	Setaria	Amaran- thus	Galium
 (112)	500	-	90	100	100
 (145)	1000	70	100	100	70

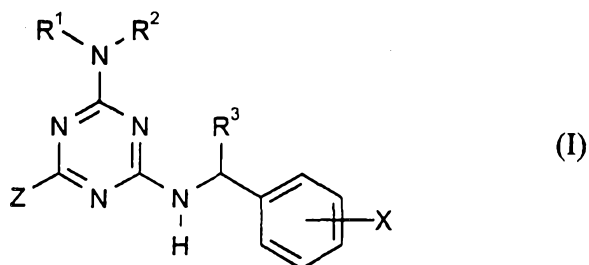
Tabelle B: (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbsp.-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Alope- curus	Setaria	Abutilon	Amaran- thus	Galium	Xanthium
<div></div>	1000	100	100	100	100	100	100

(84)

**Patentansprüche**

1. Substituierte 2,4-Diamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I),



5

in welcher

- 10  $R^1$  für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 15  $R^2$  für Wasserstoff, für Formyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy, Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy-carbonyl substituiertes Phenylcarbonyl, Naphthylcarbonyl, Phenylsulfonyl oder Naphthylsulfonyl steht,
- 20  $R^3$  für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit
- 25 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- $X$  für einen Substituenten aus folgender Gruppe steht:

- Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano oder Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, und
- 10 Z für Wasserstoff, Hydroxy, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils
- 15 gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 20 wobei jedoch die Verbindungen
- 2-Amino-4-methoxy-6-[1-(3-chlor-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-methoxy-6-[1-(3-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-trifluormethyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-nitro-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin, 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-chlor-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin und 2-Amino-4-chlor-6-[1-(3-methyl-phenyl)-ethylamino]-1,3,5-triazin
- 30 ausgeschlossen sind.
2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß darin

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

5

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, für Formyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Phenylcarbonyl oder Phenylsulfonyl steht,

10

15

R<sup>3</sup> für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

20

X für einen Substituenten aus folgender Gruppe steht:

Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Iod, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor oder Chlor substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, und

25

30

5                   Z       für Wasserstoff, Hydroxy, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, 10 Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

wobei die in Anspruch 1 genannten sechs Einzelverbindungen ausgeschlossen sind.

15

3.       Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß darin

20                   R<sup>1</sup>       für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

25                   R<sup>2</sup>       für Wasserstoff, für Formyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Phenylcarbonyl oder Phenylsulfonyl steht,

30

R<sup>3</sup>       für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder

Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

X für einen Substituenten aus folgender Gruppe steht:

5

10

15

Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, und

20

25

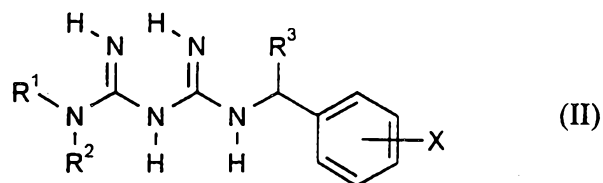
Z für Wasserstoff, Hydroxy, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl oder Butinyl steht,

30

wobei die in Anspruch 1 genannten sechs Einzelverbindungen ausgeschlossen sind.

4. Verfahren zur Herstellung von neuen Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man

(a) substituierte Biguanide der allgemeinen Formel (II)



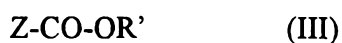
5 in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und X die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) -

10

mit Alkoxycarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (III)



15 in welcher

Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat und

$R'$  für Alkyl steht,

20

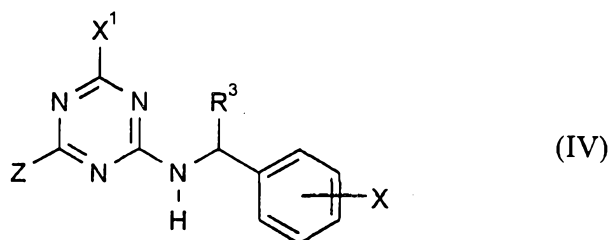
gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder daß man

25

(b) substituierte Aminotriazine der allgemeinen Formel (IV)





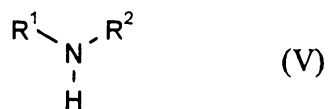
in welcher

5  $R^3$ , X und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

$X^1$  für Halogen oder Alkoxy steht,

mit Stickstoffverbindungen der allgemeinen Formel (V)

10



in welcher

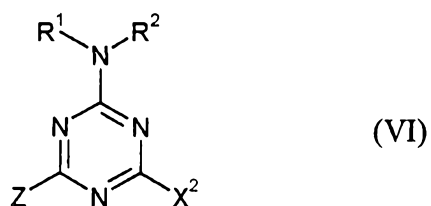
15  $R^1$  und  $R^2$  die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

20

oder daß man

(c) substituierte Aminotriazine der allgemeinen Formel (VI)



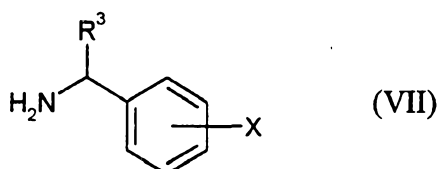
in welcher

5             $R^1$ ,  $R^2$  und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

$X^2$  für Halogen oder Alkoxy steht,

mit Aminoverbindungen der allgemeinen Formel (VII)

10



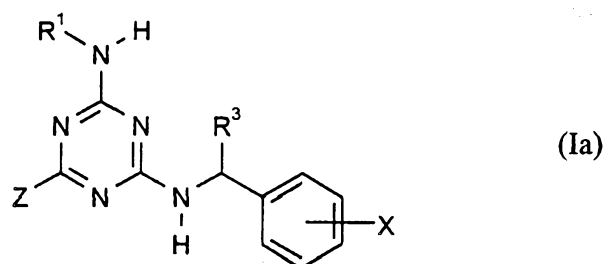
in welcher

15             $R^3$  und X die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in  
Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

20            oder daß man

(d) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I), ausgenommen solche  
mit  $R^2 = H$ , 2,4-Diamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (Ia)



in welcher

5  $R^1$ ,  $R^3$ , X und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Alkylierungs-, Acylierungs- oder Sulfonylierungsmitteln der allgemeinen Formel (VIII)

10  $Y-R^2$  (VIII)

in welcher

$R^2$  die oben angegebene Bedeutung - ausgenommen Wasserstoff - hat und

15

Y für Halogen, Alkoxy, Alkoxysulfonyloxy oder Acyloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

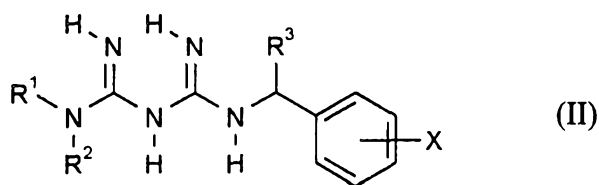
20

und gegebenenfalls an den gemäß den unter (a), (b), (c) oder (d) beschriebenen Verfahren erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der obigen Substituentendefinition weitere Umwandlungen nach üblichen Methoden durchführt.

25

5. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer neuen Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1.

6. Verwendung von neuen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwachstum.
7. Verfahren zur Bekämpfung von Unkräutern, dadurch gekennzeichnet, daß man neue Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Unkräuter oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
8. Verfahren zur Herstellung von herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man neue Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.
9. Substituierte Biguanide der allgemeinen Formel (II),



15

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und X die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben,

20

und deren Säureaddukte

ausgenommen die Verbindung 1-[1-(4-Trifluormethyl-phenyl)-ethyl]-biguanid.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

national Application No

PCT/EP 97/05317

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07D251/18 A01N43/68 C07D251/50 C07D251/52

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

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D A01N

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

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

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 300 313 A (BAYER AG) 25 January 1989 Example 73,75,79,83,85,88,93,95,101,102,110,112, 113,116 ; Claims	1,5
Y	Example 74,82,92,98,111	1,5
X	DE 39 00 300 A (BAYER AG) 12 July 1990 see example 2	1,5

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### Special categories of cited documents:

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

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

Date of the actual completion of the international search

9 February 1998

Date of mailing of the international search report

25/02/1998

Name and mailing address of the ISA

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

Authorized officer

Van Bijlen, H

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

I. International Application No

PCT/EP 97/05317

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 109, no. 15, 10 October 1988 Columbus, Ohio, US; abstract no. 129062v, TAKEMATSU, TETSUO ET AL: "Preparation of triazine derivatives as herbicides" XP002055062 cited in the application see abstract & JP 62 294 669 A (IDEMITSU KOSAN CO., LTD.) ----	1,5
Y	EP 0 411 153 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 6 February 1991 cited in the application Page 25, Example 36 - Page 27 ----	1,5
Y	EP 0 191 496 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 20 August 1986 cited in the application see claims ----	1,5
A	US 3 816 419 A (BARRINGTON CROSS ET AL) 11 June 1974 cited in the application see claims -----	1,5

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

national Application No

PCT/EP 97/05317

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 300313 A	25-01-89	DE 3801113 A AU 1974788 A DK 412588 A JP 1047772 A US 4874420 A	02-02-89 27-01-89 24-01-89 22-02-89 17-10-89
DE 3900300 A	12-07-90	NONE	
EP 411153 A	06-02-91	AT 142630 T AU 628138 B AU 5082790 A CA 2027562 A,C DE 69028461 D DE 69028461 T EP 0620220 A ES 2094150 T WO 9009378 A JP 7112981 A JP 7039400 B KR 9401728 B LV 10864 B RU 2058983 C US 5403815 A US 5290754 A LT 640 A,B	15-09-96 10-09-92 05-09-90 21-08-90 17-10-96 06-02-97 19-10-94 16-01-97 23-08-90 02-05-95 01-05-95 05-03-94 20-06-96 27-04-96 04-04-95 01-03-94 27-12-94
EP 191496 A	20-08-86	JP 1825109 C JP 5033703 B JP 61189277 A CN 1004204 B US 4680054 A	28-02-94 20-05-93 22-08-86 17-05-89 14-07-87
US 3816419 A	11-06-74	US 3932167 A	13-01-76

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

i. nationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/05317

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07D251/18 A01N43/68 C07D251/50 C07D251/52

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

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 300 313 A (BAYER AG) 25. Januar 1989 * Beispiele 73,75,79,83,85,88,93,95,101,102,110,112, 113,116 ; Ansprüche *	1,5
Y	* Beispiele 74,82,92,98,111 *	1,5
X	DE 39 00 300 A (BAYER AG) 12. Juli 1990 siehe Beispiel 2 --- -/-	1,5

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

9. Februar 1998

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

25/02/1998

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

Bevollmächtigter Bediensteter

Van Bijlen, H



## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 109, no. 15, 10.Oktober 1988 Columbus, Ohio, US; abstract no. 129062v, TAKEMATSU, TETSUO ET AL: "Preparation of triazine derivatives as herbicides" XP002055062 in der Anmeldung erwähnt siehe Zusammenfassung & JP 62 294 669 A (IDEMITSU KOSAN CO., LTD.) ---	1,5
Y	EP 0 411 153 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 6.Februar 1991 in der Anmeldung erwähnt * Seite 25, Beispiel 36 - Seite 27 * ---	1,5
Y	EP 0 191 496 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 20.August 1986 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche ---	1,5
A	US 3 816 419 A (BARRINGTON CROSS ET AL) 11.Juni 1974 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche -----	1,5

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

I. Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/05317

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 300313 A	25-01-89	DE 3801113 A	02-02-89
		AU 1974788 A	27-01-89
		DK 412588 A	24-01-89
		JP 1047772 A	22-02-89
		US 4874420 A	17-10-89
DE 3900300 A	12-07-90	KEINE	
EP 411153 A	06-02-91	AT 142630 T	15-09-96
		AU 628138 B	10-09-92
		AU 5082790 A	05-09-90
		CA 2027562 A,C	21-08-90
		DE 69028461 D	17-10-96
		DE 69028461 T	06-02-97
		EP 0620220 A	19-10-94
		ES 2094150 T	16-01-97
		WO 9009378 A	23-08-90
		JP 7112981 A	02-05-95
		JP 7039400 B	01-05-95
		KR 9401728 B	05-03-94
		LV 10864 B	20-06-96
		RU 2058983 C	27-04-96
		US 5403815 A	04-04-95
		US 5290754 A	01-03-94
		LT 640 A,B	27-12-94
EP 191496 A	20-08-86	JP 1825109 C	28-02-94
		JP 5033703 B	20-05-93
		JP 61189277 A	22-08-86
		CN 1004204 B	17-05-89
		US 4680054 A	14-07-87
US 3816419 A	11-06-74	US 3932167 A	13-01-76