

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
15. Januar 2009 (15.01.2009)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2009/007187 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 403/04 (2006.01) *A61K 31/506* (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2008/057193
- (22) Internationales Anmeldedatum:
10. Juni 2008 (10.06.2008)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
07112074.5 9. Juli 2007 (09.07.2007) EP
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **BASF SE** [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **RHEINHEIMER, Joachim** [DE/DE]; Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen (DE). **VRETTOU, Marianna** [GR/DE]; Am Oberen Luisenpark, 22, 68165 Mannheim (DE). **MÜLLER, Bernd** [DE/DE]; Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal (DE). **GROTE, Thomas** [DE/DE]; Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim (DE).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: **BASF SE**; 67056 Ludwigshafen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- Veröffentlicht:
— mit internationalem Recherchenbericht



WO 2009/007187 A1

(54) Title: SUBSTITUTED 5-HETARYLPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE 5-HETARYLPYRIMIDINE

(57) Abstract: The present invention relates to 5-hetarylpyrimidines and to the salts thereof, and to the use of these compounds for controlling phytopathogenic fungi, arthropodal plant pests and/or nematodes, and as a medicament. The invention also relates to crop protection compositions and pharmaceutical compositions which comprise at least one such compound as an active constituent.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft 5-Hetarylpyrimidine und deren Salze sowie die Verwendung dieser Verbindungen zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Pilzen, arthropoden Pflanzenschädlingen und/oder Nematoden und als Arzneimittel. Die Erfindung betrifft auch Pflanzenschutzmittel und pharmazeutische Mittel, die wenigstens eine derartige Verbindung als wirksamen Bestandteil enthalten.

Substituierte 5-Hetarylpyrimidine

Beschreibung

5 Die vorliegende Erfindung betrifft 5-Hetarylpyrimidine und deren Salze sowie die Verwendung dieser Verbindungen zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Pilzen, arthropoden Pflanzenschädlingen und/oder Nematoden und als Arzneimittel. Die Erfindung betrifft auch Pflanzenschutzmittel und pharmazeutische Mittel, die wenigstens eine derartige Verbindung als wirksamen Bestandteil enthalten.

10

Aus der WO 2004/087678 und WO 2005/070899 sind 5-Phenylpyrimidine, die in der 4-Position einen über C gebundenen aliphatischen, carbo- oder heterocyclischen Rest tragen, und deren Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Pilzen (pflanzenpathogenen Pilzen) bekannt.

15

Ferner beschreibt die WO 01/96314 fungizid wirksame Pyrimidine, die in der 4-Position einen über C gebundenen aliphatischen, carbo- oder heterocyclischen Rest tragen können und die in der 5-Position durch Phenyl, Cycloalkyl oder Heteroaryl substituiert sein können. Die hierin beschriebenen substituierten Pyrimidine weisen in der 2-Position stets einen Cyano-substituierten Aminorest auf. Die aus dem Stand der Technik bekannten 5-Phenyl- und Hetarylpyrimidine sind hinsichtlich ihrer fungiziden Wirkung teilweise nicht zufriedenstellend oder besitzen unerwünschte Eigenschaften, wie eine geringe Nutzpflanzenverträglichkeit.

25

Die WO 2005/030216 beschreibt 5-Phenylpyrimidine, die in der 4-Position durch eine sekundäre Aminogruppe oder eine Cycloalkylgruppe substituiert sind und in der 2-Position eine Aminogruppe, eine Cyanamidgruppe, einen Aryl- oder einen Hetaryl-substituenten tragen. Diese Verbindungen sollen für die Behandlung von Krebs geeignet sein.

30

Des Weiteren beschreiben die jüngeren internationalen Patentanmeldungen PCT/EP2007/052888 und PCT/EP2007/053332 die Verwendung von 5-Hetarylpyrimidinen zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen, die in der 4-Position einen über Stickstoff bzw. über ein Chalkogenatom gebundenen aliphatischen, carbo- oder heterocyclischen Rest tragen.

35

Die aus dem Stand der Technik bekannten 5-Phenylpyrimidine sind hinsichtlich ihrer pharmazeutischen Wirkung und/oder Nebenwirkungen teilweise nicht zufriedenstellend.

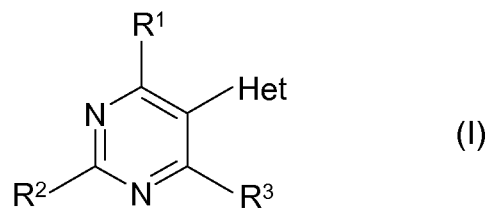
Der vorliegenden Erfindung liegt daher die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit besserer fungizider Wirksamkeit und/oder einer besseren Nutzpflanzenverträglichkeit bereitzustellen.

5

Der vorliegenden Erfindung liegt die weitere Aufgabe zugrunde, neue Pyrimidinverbindungen mit einer im Vergleich zu den Pyrimidinen des Standes der Technik verbesserten pharmakologischen Wirkung bereitzustellen.

10 Diesen und weitere Aufgaben werden überraschenderweise gelöst durch 5-Hetarylpyrimidine der im Folgenden definierten allgemeinen Formel I und durch die Salze der Verbindungen I.

15 Die vorliegende Erfindung betrifft somit die 5-Hetarylpyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I und Salze



worin

20 R^1 für C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkyl oder C_3 - C_{10} -Cycloalkenyl, steht, und wobei die aliphatischen, alicyclischen Gruppen der Res-
 tedefinitionen von R^1 teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder
 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten L^{R1} tragen können:

25 L^{R1} Cyano, Cyanato (OCN), Nitro, Hydroxy, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl,
 C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_1 - C_{10} -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_3 - C_{10} -Alkinyloxy, C_1 - C_{10} -
 Alkylcarbonyloxy, C_2 - C_{10} -Alkenylcarbonyloxy, C_2 - C_{10} -Alkynylcarbonyloxy,
 C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkenyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkoxy, C_4 - C_{10} -Cyclo-
 alkenyloxy, C_4 - C_{10} -Alkadienyl, Oxy- C_1 - C_3 -alkylenoxy, $-C(=O)-A^1$,
 30 $-C(=O)-O-A^1$, $-C(=O)-N(A^2)A^1$, $-C(=N-OA^3)(NA^2A^1)$,
 $-C(=N-NA^{2a}A^{1a})(NA^2A^1)$, $C(=S)-A^4$, $C(=S)-O-A^1$, $-C(=S)-NA^2A^1$, $-N(A^2)A^1$,
 $-N(A^2)-C(=O)-A^1$, $-N(A^3)-C(=O)-N(A^2)A^1$, $-S(=O)_m-A^4$, $-S(=O)_m-O-A^1$ oder
 $-S(=O)_m-N(A^2)A^1$, wobei zwei vicinale Substituenten L^{R1} auch zusammen
 für $(=O)$ oder $(=S)$ stehen können; wobei

35

m für 0, 1 oder 2 steht;

A¹, A^{1a}, A², A^{2a}, A³ und A⁴ unabhängig voneinander für H, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl oder Phenyl stehen;

5

A⁴ zusätzlich auch für Hydroxy, Amino, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-Alkyl)amino stehen kann;

oder A¹ und A² und/oder A^{1a} und A^{2a} bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen vier-, fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, der 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglieder aufweist und 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringglieder enthalten kann;

10

15

oder L^{R1} steht für Phenyl, Naphthyl, einen 5-, 6-, 7-, 8-, 9- oder 10-gliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, der 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglieder aufweist und 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringglieder enthalten kann;

20

wobei die aliphatischen, alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L^{R1} ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L¹¹ tragen können:

25

L¹¹ Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₄-C₈-Alkadienyl, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkynyloxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)-amino, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminothiocarbonyl oder Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl;

30

35

oder L¹¹ steht für C₃-C₁₀-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Bicycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkoxy; gesättigtes oder teilweise ungesättigtes C₃-C₁₀-Heterocyclyl oder C₃-C₁₀-Heterocyclyloxy, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, Hetaryloxy oder Hetarylthio, wobei die fünf letztgenannten Reste jeweils 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, S und N als Ringglieder aufweisen und 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringglieder

40

enthalten können; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy oder Aryl-C₁-C₆-alkyl, wobei die Arylreste jeweils 6, 7, 8, 9 oder 10 Ringglieder aufweisen; und wobei die cyclischen Systeme durch 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene C₁-C₆-Alkyl- oder C₁-C₆-Halogenalkylreste substituiert sein können;

und wobei die aliphatischen, alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L¹¹ ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können;

R² für Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, N₃, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, oder für einen Rest der Formeln C(=Z)OR²¹, C(=Z)NR²²R²³, C(=Z)NR²⁴-NR²²R²³, C(=Z)R²⁵, CR²⁶R²⁷-OR²⁸, CR²⁶R²⁷-NR²²R²³, ON(=CR²⁹R³⁰), O-C(=Z)R²⁵, NR³¹(C(=Z)R²⁵), NR³¹(C(=Z)OR²¹), NR³¹(C(=Z)-NR²²R²³), NR^{32a}(N=CR²⁹R³⁰), NR³²NR²²R²³, NR³²OR²¹ oder C(=N-Z'-R²⁵)SR²¹ steht; wobei

Z für O, S, NR³³, NOR³⁴ oder N-NR³⁵R³⁶ steht;

Z' für eine chemische Bindung, Sauerstoff, eine Carbonylgruppe, eine Gruppe NR³² oder eine der folgenden Gruppen: -(C=O)-NH- oder -(C=O)-O- steht, wobei die Carbonylgruppe an das Stickstoffatom gebunden ist;

R²¹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R²⁸, R²⁹, R³⁰, R³¹, R³², R^{32a}, R³³, R³⁴, R³⁵ und R³⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₄-C₈-Cycloalkenyl stehen;

R^{23a} bis auf Wasserstoff eine der für R²¹ angegebenen Bedeutungen aufweist;

R²², R²⁸ und R³² unabhängig voneinander zusätzlich auch -CO-R²⁵ bedeuten können;

R²² weiterhin -CO-OR²¹ oder -CO-NR²³R^{23b} bedeuten kann, wobei R^{23b} eine der für R²¹ angegebenen Bedeutungen aufweist;

R²² und R²³ oder R²² und R^{23a} auch gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-, 5-, 6- oder 7-gliedrigen gesättigten oder teilweise ungesättigten Heterocyclus, der ein Sauerstoffatom als Ringglied aufweisen kann und/oder eine Doppelbindung enthalten kann, bilden kön-

nen;

5 R^{31} , R^{32} , R^{32a} , R^{33} , R^{34} oder R^{35} mit einem weiteren Rest R^{21} , R^{22} , R^{23} , R^{24} , R^{25} oder R^{31} auch gemeinsam eine C_1 - C_6 -Alkylengruppe bilden können, die im Falle von C_2 - C_6 -Alkylen eine Doppelbindung aufweisen kann;

10 R^{26} und R^{22} , R^{26} und R^{27} , R^{26} und R^{28} oder R^{29} und R^{30} auch gemeinsam eine C_3 - C_6 -Alkylengruppe bilden können, wobei der hieraus erhaltene Ring ein Sauerstoffatom als Ringglied aufweisen kann und/oder eine Doppelbindung enthalten kann;

R^{30} auch für einen Rest der Formel $A-CO-OR^{21}$ oder $-CO-NR^{23}R^{23b}$ stehen kann, worin A für C_1 - C_4 -Alkylen steht;

15 R^{31} auch für eine Gruppe der Formeln $NR^{22}R^{23}$, $N=CR^{29}R^{30}$ oder $N=C(R^{25})NR^{22}R^{23}$ stehen kann;

20 wobei die aliphatischen und/oder alicyclischen Gruppen der Restdefinitionen von R^{21} - R^{36} ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten R^w tragen können:

25 R^w Halogen, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy oder C_3 - C_6 -Cycloalkenyloxy; oder

30 R^2 für einen cyclischen Rest steht, der unter C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, Phenyl, 5-, 6- oder 7-gliedrigen aromatischen Heterocyclen und C-gebundenen, 5-, 6- oder 7-gliedrigen gesättigten oder partiell ungesättigten Heterocyclen, wobei die gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclen 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N und S aufweisen und 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringlieder enthalten können, ausgewählt ist, wobei die alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^2 teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L^{R2} aufweisen können:

35 L^{R2} Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), Nitro, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_2 - C_{10} -Alkynylcarbonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkylcarbonyl, NR^5R^6 , $NR^5-C(=O)-R^6$, $NR^5-C(=S)-R^6$, $S(=O)_nB^1$, $C(=O)B^2$, $C(=S)B^2$, eine Gruppe $-C(=N-OR^7)B^3$, eine Gruppe $-C(=N-NR^8R^9)B^4$, Phenyl oder ein 5-, 6-, 7-, 8-, 9- oder

40

- 10-gliedriger gesättigter, teilweise ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, der 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S als Ringglieder aufweist, und worin Phenyl und der Heterocyclus unsubstituiert sind oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten aufweisen können, die unter Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₂-Alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, Amino, C₁-C₄-Alkyl-amino und Di-(C₁-C₄-Alkyl)-amino ausgewählt sind; worin
- 5
- R⁵, R⁶ unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl und C₃-C₆-Cycloalkenyl, wobei die 5 letztgenannten Reste 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten, ausgewählt unter Cyano, C₁-C₄-Alkoxyimino, C₂-C₄-Alkenyloximino, C₂-C₄-Alkynyloximino und C₁-C₄-Alkoxy, aufweisen können;
- 10
- 15
- B¹ für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, Amino, C₁-C₈-Alkyl-amino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)amino steht;
- n für 0, 1 oder 2 steht;
- 20
- B² für C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkynyloxy oder einen der bei B¹ genannten Reste steht;
- B³ und B⁴ unabhängig voneinander für C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkynyloxy oder einen Rest NR¹⁰R¹¹ stehen;
- 25
- R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkynyl, wobei die vier letztgenannten Reste 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 gleiche oder verschiedene Substituenten R^a aufweisen können; oder R⁸ und R⁹ und/oder R¹⁰ und R¹¹ bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-, 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder teilweise ungesättigten Ring, der 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten R^b aufweisen kann; wobei
- 30
- 35
- R^a, R^b unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy stehen;

und wobei die aliphatischen, alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restedefinitionen von L^{R2} ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können;

- 5 R^3 für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl oder C_2 - C_8 -Alkinyl, wobei die drei letztgenannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 Substituenten, ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C_1 - C_2 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino und Di-(C_1 - C_4 -Alkyl)-amino, aufweisen können;
- 10 Het für einen C- oder N-gebundenen, 5- oder 6-gliedrigen aromatischen Heterocyclus steht, der 1, 2, 3 oder 4 unter N, O und S ausgewählte Heteroatome als Ringglieder aufweist und der teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweisen kann:
- 15 L Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), Nitro, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkinyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyl-oxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_2 - C_{10} -Alkinylcarbonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkylcarbonyl, $NR^{55}R^{66}$, $NR^{55a}-C(=O)-R^{66a}$, $NR^{55a}-C(=S)-R^{66a}$, $S(=O)_2C^1$, $C(=O)C^2$, $C(=S)C^2$, eine Gruppe $-C(=N-OR^{77})C^3$, eine Gruppe $-C(=N-NR^{88}R^{99})C^4$, Phenyl oder ein 5-, 6-, 7-, 8-, 9- oder 10-gliedriger gesättigter, teilweise ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, der 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglieder aufweist, und worin Phenyl und der Heterocyclus unsubstituiert sind oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten aufweisen können, die unter Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C_1 - C_2 -Alkyl, C_1 - C_2 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl, C_1 - C_4 -Alkylcarbonyl, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino und Di-(C_1 - C_4 -Alkyl)amino ausgewählt sind, worin
- 20 R^{55} , R^{66} , R^{55a} , R^{66a} unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkinyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl und C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, wobei die aliphatischen Gruppen der Restedefinitionen von R^{55} und/oder R^{66} teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2, 3 oder 4 Cyanosubstituenten aufweisen können; und wobei die aliphatischen Gruppen der Restedefinitionen von R^{55a} und/oder R^{66a} sowie die alicyclischen Restedefinitionen von R^{55} , R^{66} , R^{55a} und/oder R^{66a} teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten, ausgewählt unter Cyano, C_1 - C_4 -Alkoximino, C_2 - C_4 -Alkenyloximino, C_2 - C_4 -Alkinylloximino und C_1 - C_4 -Alkoxy, aufweisen können;
- 30
- 35
- 40

8

C¹ für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, Amino, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)-amino steht;

r für 0, 1 oder 2 steht;

5

C² für C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy oder einen der bei C¹ genannten Reste steht;

10

C³ und C⁴ unabhängig voneinander für C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy oder einen Rest NR^{10a}R^{11a} stehen;

15

R⁷⁷, R⁸⁸, R⁹⁹, R^{10a}, R^{11a} unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl und C₂-C₆-Alkynyl, wobei die vier letztgenannten Reste 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 gleiche oder verschiedene Substituenten R^{aa} aufweisen können; oder R⁸⁸ und R⁹⁹ und/oder R^{10a} und R^{11a} zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bilden einen 4-, 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder teilweise ungesättigten Ring, der 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten R^{bb} aufweisen kann; wobei

20

R^{aa}, R^{bb} unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy stehen;

25

und wobei die aliphatischen, alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können.

30

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist auch die Verwendung von 5-Hetarylpyrimidinen und ihren Salzen zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen (Schadpilzen).

35

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin ein Pflanzenschutzmittel, das insbesondere zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen (Schadpilzen) geeignet ist, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz davon und wenigstens einen flüssigen oder festen Trägerstoff.

40

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit

einer wirksamen Menge wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Formel I und/oder einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I behandelt.

5 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin die Verwendung von 5-Hetarylpyrimidinen der allgemeinen Formel I und/oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I zur Bekämpfung von arthropoden Pflanzenschädlingen und/oder zur Bekämpfung von Nematoden.

10 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin ein Mittel zur Bekämpfung von arthropoden Pflanzenschädlingen und/oder zur Bekämpfung von Nematoden, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz davon und wenigstens einen flüssigen oder festen Trägerstoff.

15 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin ein Verfahren zur Bekämpfung von arthropoden Pflanzenschädlingen und/oder Nematoden, bei dem man die arthropoden Pflanzenschädlinge und/oder Nematoden oder die vor Befall mit diesen Schadorganismen zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Boden mit einer wirksamen Menge wenigstens einer Verbindung der Formel I und/oder einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I behandelt.

20 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin ein Saatgut, enthaltend wenigstens ein 5-Hetarylpyrimidin der Formel I und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz von I.

25 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin die Verwendung von 5-Hetarylpyrimidinen der allgemeinen Formel I und/oder eines pharmazeutisch verträglichen Salzes davon als Arzneimittel, bzw. zur Herstellung eines Medikaments, das insbesondere zur Behandlung von Krebserkrankungen geeignet ist.

30 Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind weiterhin pharmazeutische Zusammensetzungen (Medikamente bzw. Arzneimittel), enthaltend wenigstens ein 5-Hetarylpyrimidin der allgemeinen Formel I und/oder ein pharmazeutisch verträgliches Salz davon und einen pharmazeutisch verträglichen Träger.

35 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin die Verwendung von 5-Hetarylpyrimidinen der allgemeinen Formel I und/oder deren pharmazeutisch verträglicher Salze zur Herstellung eines Medikaments zur Behandlung von Krebserkrankungen.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin ein Verfahren zur Behandlung von Krebserkrankungen bei Säugern, bei dem man dem Säuger, der dies benötigt, eine wirksame Menge eines 5-Hetarylpyrimidins der allgemeinen Formel I und/oder eines pharmazeutisch geeigneten Salzes davon verabreicht.

Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren aufweisen und liegen dann als Enantiomeren- oder Diastereomeren-gemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomere oder Diastereomere als auch deren Gemische, z. B. Racemate. Geeignete Verbindungen der allgemeinen Formel I umfassen auch alle möglichen Stereoisomere (cis/trans-Isomere) und Gemische davon.

Unter landwirtschaftlich brauchbaren bzw. geeigneten Salzen kommen vor allem die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die fungizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen. So kommen als Kationen insbesondere die Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium, Magnesium und Barium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie das Ammoniumion, das gewünschtenfalls ein bis vier C₁-C₄-Alkylsubstituenten und/oder einen Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Phosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat, sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat. Sie können durch Reaktion von I mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

Als pharmazeutisch verträgliche bzw. geeignete Salze kommen vor allem physiologisch tolerierte Salze der Verbindung I in Betracht, insbesondere die Säureadditionssalze mit physiologisch verträglichen Säuren. Beispiele für geeignete organische und anorganische Säuren sind Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, C₁-C₄-Alkylsulfonsäuren wie Methansulfonsäure, cycloalipha-

tische Sulfonsäuren wie S-(+)-10-Camphersulfonsäure, aromatische Sulfonsäuren wie Benzolsulfonsäure, cis- und trans-Zimtsäure, Furoesäure und Toluolsulfonsäure, C₂-C₁₀-Hydroxycarbonsäuren wie Glykolsäure, Di- und Tri-C₂-C₁₀-carbonsäuren und -hydroxycarbonsäuren wie Oxalsäure, Malonsäure, Maleinsäure, Fumarsäure, Milchsäure, Weinsäure, Adipinsäure, Zitronensäure, Schleimsäure und Benzoessäure. Weitere geeignete Säuren sind beispielsweise in Fortschritte der Arzneimittelforschung, Band 10, Seiten 224 ff., Birkhäuser Verlag, Basel und Stuttgart, 1966 beschrieben, worauf hiermit in vollem Umfang Bezug genommen wird. Die physiologisch tolerierten Salze der Verbindungen I können als Mono-, Bis-, Tris- and Tetrakis-Salze vorliegen, d. h. sie können 1, 2, 3 oder 4 der vorgenannten Säuremoleküle pro Molekül der Formel I aufweisen. Die Säuremoleküle können in protonierter Form oder als Anionen vorliegen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Variablen werden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die jeweiligen Substituenten stehen. Die Bedeutung C_n-C_m gibt die jeweils mögliche Anzahl von Kohlenstoffatomen in dem jeweiligen Substituenten oder Substituententeil an:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Iod;

20

Alkyl sowie die Alkylteile in Alkyloxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl und Alkylsulfonyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl und dergleichen;

30

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

35

Alkenyl sowie die Alkenylteile in Alkenyloxy: einfach ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 2 bis 6, 2 bis 8 oder 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z. B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl und dergleichen;

Alkadienyl: zweifach ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4 bis 10 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in einer beliebigen Position z.B. 1,3-Butadienyl, 1-Methyl-1,3-butadienyl, 2-Methyl-1,3-butadienyl, Penta-1,3-dien-1-yl, Hexa-1,4-dien-1-yl, Hexa-1,4-dien-3-yl, Hexa-1,4-dien-6-yl, Hexa-1,5-dien-1-yl, Hexa-1,5-dien-3-yl, Hexa-1,5-dien-4-yl, Hepta-1,4-dien-1-yl, Hepta-1,4-dien-3-yl, Hepta-1,4-dien-6-yl, Hepta-1,4-dien-7-yl, Hepta-1,5-dien-1-yl, Hepta-1,5-dien-3-yl, Hepta-1,5-dien-4-yl, Hepta-1,5-dien-7-yl, Hepta-1,6-dien-1-yl, Hepta-1,6-dien-3-yl, Hepta-1,6-dien-4-yl, Hepta-1,6-dien-5-yl, Hepta-1,6-dien-2-yl, Octa-1,4-dien-1-yl, Octa-1,4-dien-2-yl, Octa-1,4-dien-3-yl, Octa-1,4-dien-6-yl, Octa-1,4-dien-7-yl, Octa-1,5-dien-1-yl, Octa-1,5-dien-3-yl, Octa-1,5-dien-4-yl, Octa-1,5-dien-7-yl, Octa-1,6-dien-1-yl, Octa-1,6-dien-3-yl, Octa-1,6-dien-4-yl, Octa-1,6-dien-5-yl, Octa-1,6-dien-2-yl, Deca-1,4-dienyl, Deca-1,5-dienyl, Deca-1,6-dienyl, Deca-1,7-dienyl, Deca-1,8-dienyl, Deca-2,5-dienyl, Deca-2,6-dienyl, Deca-2,7-dienyl, Deca-2,8-dienyl und dergleichen;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in beliebiger Position (wie vor-

stehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

- 5 Alkynyl sowie die Alkynylteile in Alkynyloxy: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 2 bis 6, 2 bis 8 oder 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₆-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-
- 10 butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-
- 15 butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl und dergleichen;

- Cycloalkyl sowie die Cycloalkylteile in Cycloalkoxy: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 8 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, 20 Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

- Cycloalkenyl: monocyclische, einfach ungesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 8, vorzugsweise 5 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopenten-1-yl, Cyclopenten-3-yl, Cyclohexen-1-yl, Cyclohexen-3-yl, Cyclohexen-4-yl und dergleichen;
- 25

- Bicycloalkyl: bicyclischer Kohlenwasserstoffrest mit 5 bis 10 C-Atomen wie Bicyclo[2.2.1]hept-1-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-7-yl, Bicyclo[2.2.2]oct-1-yl, Bicyclo[2.2.2]oct-2-yl, Bicyclo[3.3.0]octyl, Bicyclo[4.4.0]decyl und dergleichen;

- 30 C₁-C₄-Alkoxy: für eine über ein Sauerstoff gebundene Alkylgruppe mit 1 bis 4 C-Atomen: z. B. Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy oder 1,1-Dimethylethoxy;

- C₁-C₈-Alkoxy: für C₁-C₄-Alkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z. B. Pentoxy, 35 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy,

3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy,
1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy oder 1-Ethyl-2-methylpropoxy;

C₁-C₄-Halogenalkoxy: für einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend genannt, der partiell
5 oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod, vorzugsweise durch Fluor substituier-
t ist, also z.B. OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, Chlorfluor-
methoxy, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy,
2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-
fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy,
10 OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy,
2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy,
3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-
fluorethoxy, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy, 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy,
4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy oder Nonafluorbutoxy;

15

C₁-C₈-Halogenalkoxy: für C₁-C₄-Halogenalkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z. B.
5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy,
6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy oder Dodecafluorhexoxy;

20 Alkenyloxy: Alkenyl wie vorstehend genannt, das über ein Sauerstoffatom gebunden
ist, z. B. C₃-C₆-Alkenyloxy wie 1-Propenyloxy, 2-Propenyloxy, 1-Methylethyloxy,
1-Butenyloxy, 2-Butenyloxy, 3-Butenyloxy, 1-Methyl-1-propenyloxy, 2-Methyl-1-
propenyloxy, 1-Methyl-2-propenyloxy, 2-Methyl-2-propenyloxy, 1-Pentenyloxy,
2-Pentenyloxy, 3-Pentenyloxy, 4-Pentenyloxy, 1-Methyl-1-butenyloxy, 2-Methyl-1-
25 butenyloxy, 3-Methyl-1-butenyloxy, 1-Methyl-2-butenyloxy, 2-Methyl-2-butenyloxy,
3-Methyl-2-butenyloxy, 1-Methyl-3-butenyloxy, 2-Methyl-3-butenyloxy, 3-Methyl-3-
butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyloxy, 1,2-Dimethyl-1-propenyloxy, 1,2-Dimethyl-2-
propenyloxy, 1-Ethyl-1-propenyloxy, 1-Ethyl-2-propenyloxy, 1-Hexenyloxy,
2-Hexenyloxy, 3-Hexenyloxy, 4-Hexenyloxy, 5-Hexenyloxy, 1-Methyl-1-pentenyloxy,
30 2-Methyl-1-pentenyloxy, 3-Methyl-1-pentenyloxy, 4-Methyl-1-pentenyloxy, 1-Methyl-2-
pentenyloxy, 2-Methyl-2-pentenyloxy, 3-Methyl-2-pentenyloxy, 4-Methyl-2-pentenyloxy,
1-Methyl-3-pentenyloxy, 2-Methyl-3-pentenyloxy, 3-Methyl-3-pentenyloxy, 4-Methyl-3-
pentenyloxy, 1-Methyl-4-pentenyloxy, 2-Methyl-4-pentenyloxy, 3-Methyl-4-pentenyloxy,
4-Methyl-4-pentenyloxy, 1,1-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,1-Dimethyl-3-butenyloxy,
35 1,2-Dimethyl-1-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-3-butenyloxy,
1,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-3-butenyloxy,
2,2-Dimethyl-3-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-2-butenyloxy,
2,3-Dimethyl-3-butenyloxy, 3,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 3,3-Dimethyl-2-butenyloxy,
1-Ethyl-1-butenyloxy, 1-Ethyl-2-butenyloxy, 1-Ethyl-3-butenyloxy, 2-Ethyl-1-butenyloxy,

2-Ethyl-2-butenyloxy, 2-Ethyl-3-butenyloxy, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyloxy und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyloxy;

- 5 Alkinyloxy: Alkynyl wie vorstehend genannt, das über ein Sauerstoffatom gebunden ist, z. B. C₃-C₆-Alkinyloxy wie 2-Propinyloxy, 2-Butinyloxy, 3-Butinyloxy, 1-Methyl-2-propinyloxy, 2-Pentinyloxy, 3-Pentinyloxy, 4-Pentinyloxy, 1-Methyl-2-butinyloxy, 1-Methyl-3-butinyloxy, 2-Methyl-3-butinyloxy, 1-Ethyl-2-propinyloxy, 2-Hexinyloxy, 3-Hexinyloxy, 4-Hexinyloxy, 5-Hexinyloxy, 1-Methyl-2-pentinyloxy, 1-Methyl-3-
- 10 pentinyloxy und dergleichen;

Alkylthio: Alkyl, wie vorstehend definiert, das über ein S-Atom gebunden ist.

Alkylsulfinyl: Alkyl, wie vorstehend definiert, das über eine SO-Gruppe gebunden ist.

15

Alkylsulfonyl: Alkyl, wie vorstehend definiert, das über eine S(O)₂-Gruppe gebunden ist.

5-, 6-, 7-, 8-, 9- oder 10-gliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stick-

20 stoff oder Schwefel:

- fünf- oder sechsgliedriger gesättigter oder partiell ungesättigter Heterocyclus (im Folgenden auch Heterocyclyl), enthaltend ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglieder: z. B. mono-
- 25 cyclische gesättigte oder partiell ungesättigte Heterocyclen enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z. B.
- 30 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-
- 35 yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isloxazolin-3-yl, 3-Isloxazolin-3-yl, 4-Isloxazolin-3-yl, 2-Isloxazolin-4-yl,

- 3-Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazolin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl,
 4-Isoxazolin-5-yl, 2-Isythiazolin-3-yl, 3-Isythiazolin-3-yl, 4-Isythiazolin-3-yl,
 2-Isythiazolin-4-yl, 3-Isythiazolin-4-yl, 4-Isythiazolin-4-yl, 2-Isythiazolin-5-yl,
 3-Isythiazolin-5-yl, 4-Isythiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl,
 5 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl,
 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl,
 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl,
 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl,
 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl,
 10 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl,
 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl,
 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl,
 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl,
 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl,
 15 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl,
 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydrotriazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl sowie
 die entsprechenden -yliden-Reste;
- siebengliedriger gesättigter oder partiell ungesättigter Heterocyclus, enthaltend
 20 ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und
 Schwefel als Ringglieder: z. B. mono- und bicyclische Heterocyclen mit sieben
 Ringgliedern, enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffato-
 me und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff-
 und/oder Schwefelatome, beispielsweise Tetra- und Hexahydroazepinyl wie
 25 2,3,4,5-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl,
 3,4,5,6-Tetrahydro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl,
 2,3,4,7-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl,
 2,3,6,7-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl,
 Hexahydroazepin-1-, -2-, -3- oder -4-yl, Tetra- und Hexahydrooxepinyl wie
 30 2,3,4,5-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl,
 2,3,4,7-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl,
 2,3,6,7-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl,
 Hexahydroazepin-1-, -2-, -3- oder -4-yl, Tetra- und Hexahydro-1,3-diazepinyl,
 Tetra- und Hexahydro-1,4-diazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,3-oxazepinyl,
 35 Tetra- und Hexahydro-1,4-oxazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,3-dioxepinyl,
 Tetra- und Hexahydro-1,4-dioxepinyl und die entsprechenden -yliden-Reste.
- fünf- oder sechsgliedriger aromatischer Heterocyclus (= heteroaromatischer
 Rest, Hetaryl), enthaltend ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe

- Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, z. B. C-gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl; über Stickstoff gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder wie Pyrrol-1-yl, Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, 1,2,3-Triazol-1-yl und 1,2,4-Triazol-1-yl; 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein, zwei oder drei Stickstoffatome als Ringglieder wie Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 6 CH₂-Gruppen, z. B. CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;

- Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH₂-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z. B. OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ und OCH₂CH₂CH₂CH₂;

- Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z. B. OCH₂O, OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O.

- Hinsichtlich der fungiziden und/oder pharmazeutischen Wirksamkeit werden Verbindungen der allgemeinen Formel I bevorzugt, worin Het, R¹, R² und R³ unabhängig voneinander und insbesondere in Kombination die im Folgenden als bevorzugt angegebenen Bedeutungen aufweisen.

- Bevorzugt steht R¹ für C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl. Hierbei kann R¹ partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder einen, zwei, drei oder vier gleiche oder verschiedene Substituenten L^{R1} tragen, die wie vorstehend definiert sind.

Wenn R¹ einen, zwei, drei oder vier, vorzugsweise einen, zwei oder drei, gleiche oder verschiedene Substituenten L^{R1} trägt, so ist L^{R1} vorzugsweise ausgewählt unter Halo-

gen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkoximino, C₂-C₆-Alkenyloximino, C₂-C₆-Alkinyloximino, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl, wobei die aliphatischen und/oder alicyclischen Gruppen der Restdefinitionen von L^{R1} ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei Substituenten L¹¹ tragen können.

Sofern L^{R1} wenigstens einen Substituenten L¹¹ trägt, ist L¹¹ vorzugsweise ausgewählt unter Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Halogenalkylcarbonyl und C₁-C₆-Alkoxy.

Besonders bevorzugt steht R¹ für C₁-C₈-Alkyl, insbesondere verzweigtes C₃-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₈-Alkenyl, insbesondere verzweigtes C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, das eine C₁-C₄-Alkylgruppe aufweisen kann, oder C₅-C₆-Cycloalkenyl, das eine C₁-C₄-Alkylgruppe aufweisen kann. Stärker bevorzugt steht R¹ für verzweigtes C₃-C₈-Alkyl, wie Isopropyl, sec-Butyl, Isobutyl, tert-Butyl, 2- und 3-Pentyl, 2- und 3-Methylbutyl, 1,1-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 2- und 3-Hexyl, 2-, 3- und 4-Methylpentyl und dergleichen. Vorzugsweise befindet sich die Verzweigung nicht am Kohlenstoffatom, über den der Rest R¹ an den Pyrimidinring gebunden ist. Beispiele für solche Alkylreste sind Isobutyl, 2- und 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 2-, 3- und 4-Methylpentyl und dergleichen.

Besonders bevorzugt steht R¹ in einer alternativen Ausführungsform für C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, welches 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 unter Halogen und C₁-C₄-Alkyl ausgewählte Substituenten tragen kann, oder C₁-C₈-Halogenalkyl. Stärker bevorzugt steht R¹ für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl, welches 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten, ausgewählt unter Halogen und C₁-C₄-Alkyl, aufweisen kann.

In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung steht R² für einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen heteroaromatischen Rest. Besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R² ausgewählt ist unter Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1,2,4-Triazolyl, Tetrazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, Furyl, Thienyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, 1,2,3-Triazinyl, 1,2,4-Triazinyl und 1,3,5-Triazinyl, wobei der heterocyclische Rest R² teilweise oder vollständig halogeniert sein kann, 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringglieder enthalten kann und/oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L^{R2} aufweisen kann.

Besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R² für einen unsubstituierten heteroaromatischen Rest steht.

5 Gleichmaßen besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R² für einen heteroaromatischen Rest mit 1, 2 oder 3 Substituenten L^{R2} steht, die unabhängig voneinander unter Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkoxy, -C(=O)-B², - C(=N- OR⁷)B³, NR⁵R⁶, NR⁵-C(=O)-R⁶ ausgewählt sind.

10 Weiterhin gleichermaßen besonders bevorzugt kann der heterocyclische Rest R² teilweise oder vollständig halogeniert sein.

Ganz besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R² ausgewählt ist unter Pyrazol-1-yl, 3-Aminopyrazol-1-yl, [1,2,4]Triazol-1-yl, 3-Cyano-[1,2,4]triazol-1-yl, 15 [1,2,3]Triazol-1-yl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl, Pyridin-2-yl, (6-Methyl)-pyridin-2-yl, Pyrimidin-2-yl, Pyrazin-2-yl, Pyridazin-3-yl, [1,3]Thiazol-2-yl, (4,5-Dimethyl)-[1,3]thiazol-2-yl, 7-Aminoindazol-1-yl, Pyrazol-3-on-1-yl, 2-Hydroxyimidazol-1-yl, 3-Hydroxypyrazolin-1-yl und 5-Hydroxy-1,2,4-triazol-1-yl, wobei der heterocyclische Rest teilweise oder vollständig halogeniert sein kann.

20

Ganz besonders bevorzugt werden weiterhin Verbindungen I, in denen R² für einen aromatischen fünfgliedrigen Heterocyclus steht, welcher insbesondere über N gebunden ist und/oder durch einen, zwei oder drei Substituenten L^{R2} substituiert sein kann, wobei L^{R2} insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweist.

25 Speziell bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R² für Pyrazol-1-yl, [1,2,4]Triazol-1-yl oder [1,2,3]Triazol-1-yl steht, wobei die vorgenannten Reste unsubstituiert oder durch 1, 2 oder 3 Substituenten L^{R2} substituiert sein können.

30 Des Weiteren werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R² ausgewählt ist unter Halogen, N₃, CN, C(=Z)OR²¹, C(=Z)NR²²R²³, C(=Z)NR²⁴-NR²²R²³, C(=Z)R²⁵, ON(=CR²⁹R³⁰), O-C(=Z)R²⁵, NR²²R^{23a}, NR³¹(C(=Z)R²⁵), NR³¹(C(=Z)OR²¹), NR³¹(C(=Z)-NR²²R²³), NR³²(N=CR²⁹R³⁰), NR³²NR²²R²³, NR³²OR²¹ und C(=N-Z'-R²⁵)SR²¹.

35 In besonders bevorzugten Verbindungen der Formel I ist R² ausgewählt unter CN, C(=Z)OR²¹, C(=Z)NR²²R²³, C(=Z)NR²⁴-NR²²R²³, C(=Z)R²⁵ und C(=N-Z'-R²⁵)SR²¹.

Hierunter werden insbesondere Verbindungen I bevorzugt, in denen R² für einen der folgenden Reste steht:

- $C(=O)OR^{21}$, wie $C(=O)-C_1-C_4$ -alkyl,
 $C(=O)NR^{22}R^{23}$, wie $C(=O)NH_2$ oder $C(=O)NH-C_1-C_4$ -alkyl,
 $C(=S)NR^{22}R^{23}$, wie $C(=S)NH_2$,
 5 $C(=NOR^{34})NR^{22}R^{23}$, wie $C(=N-O-C_1-C_4$ -alkyl) NH_2 ,
 $C(=O)NR^{24}-NR^{22}R^{23}$, wie $C(=O)NHNH_2$,
 $C(=Z)R^{25}$, wie $C(=O)H$, $C(=O)-C_1-C_4$ -alkyl, $C(=NO-C_1-C_4$ -alkyl) H , und
 $C(=NO-C_1-C_4$ -alkyl)- C_1-C_4 -alkyl,
 $C(=N-OR^{25})SR^{21}$ oder
 10 $C(=N-R^{25})SR^{21}$ steht.

Hierunter werden ganz besonders bevorzugt Verbindungen I, in denen R^2 für $C(=O)NR^{22}R^{23}$, speziell $C(=O)NH_2$, oder für $C(=NOR^{34})NR^{22}R^{23}$, speziell $C(=NOCH_3)NH_2$ steht.

- 15 Ebenfalls bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, worin R^2 ausgewählt ist unter $ON(=CR^{29}R^{30})$, $O-C(=Z)R^{25}$, $NR^{22}R^{23a}$, $NR^{31}(C(=Z)R^{25})$, $NR^{31}(C(=Z)OR^{21})$, $NR^{21}(C(=Z)-NR^{22}R^{23})$, $NR^{32}(N=CR^{29}R^{30})$, $NR^{32}NR^{22}R^{23}$ und $NR^{32}OR^{41}$.

- 20 Hierunter werden insbesondere Verbindungen I bevorzugt, in denen R^2 für einen der folgenden Reste steht:

- $ON(=CR^{29}R^{30})$, wie $ON(=C(C_1-C_4$ -alkyl) $_2$),
 $NR^{31}(C(=O)R^{25})$, wie $NH(C(=O)H)$ und $NH(C(=O)-C_1-C_4$ -alkyl),
 25 $NR^{31}(C(=O)OR^{21})$, wie $NH(C(=O)O-C_1-C_4$ -alkyl),
 $NR^{31}(C(=O)-NR^{22}R^{23})$, wie $NH(C(=O)NH_2)$ oder $NH(C(=O)NH(C_1-C_4$ -alkyl)),
 $NR^{32}(N=CR^{29}R^{30})$, wie $NH(N=C(CH_3)CH(CH_3)C(=O)OC_1-C_4$ -alkyl)
 $NR^{32}OR^{21}$, wie $N(C(=O)CH_3)(O-C_1-C_4$ -alkyl),
 30 Beispiele für Reste $NR^{32}NR^{22}R^{23}$ sind $NHNHC(=O)OCH_3$, $NHNHC(=O)OC_2H_5$,
 $NHNHC(=O)OC_3H_7$, $NHNHC(=O)OC_4H_9$.

- Des Weiteren werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^3 für Halogen, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl oder C_1-C_4 -Halogenalkyl steht. Besonders bevorzugt werden Verbindungen
 35 der allgemeinen Formel I, in denen R^3 für Halogen, Cyano oder C_1-C_2 -Alkyl, wie Chlor, Fluor, Brom, Cyano, Methyl und Ethyl, insbesondere Methyl, steht. Ganz besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R^3 für Halogen und speziell für Chlor steht. Ebenfalls ganz besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R^3 für Methyl

steht. Ebenfalls ganz besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen R³ für Cyano steht.

Des Weiteren werden Verbindungen I bevorzugt, in denen Het wenigstens einen, z. B. 1, 2 oder 3, Substituenten L trägt. Bevorzugte Substituenten L an Het sind Halogen, Cyano, Nitro, NH₂, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, NH-C(O)-C₁-C₆-Alkyl, ein Rest C(S)C² und ein Rest C(O)C². Hierin hat C² die vorgenannten Bedeutungen und steht insbesondere für C₁-C₄-Alkoxy, NH₂, C₁-C₄-Alkylamino oder Di-C₁-C₄-alkylamino. Besonders bevorzugte Substituenten L sind unabhängig voneinander ausgewählt unter Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, insbesondere unter Fluor, Chlor, C₁-C₂-Alkyl wie Methyl oder Ethyl, C₁-C₂-Fluoralkyl wie Trifluormethyl, C₁-C₂-Alkoxy wie Methoxy, und C₁-C₂-Alkoxy-carbonyl wie Methoxy-carbonyl.

Des Weiteren werden Verbindungen I bevorzugt, in denen wenigstens eines der Heteroatome des heteroaromatischen Rests Het und/oder ein Substituent L in ortho-Position zur Bindungsstelle von Het an das Pyrimidingerüst der Formel I angeordnet ist. Bevorzugte Substituenten L in der ortho-Position sind Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₂-Alkyl wie Methyl oder Ethyl, C₁-C₂-Fluoralkyl wie Trifluormethyl und C₁-C₂-Alkoxy wie Methoxy.

Des Weiteren werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, worin Het wenigstens ein Ring-Stickstoffatom aufweist. Hierunter sind solche Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, worin sich das Ring-Stickstoffatom in der ortho-Position zu der Bindungsstelle von Het an die 5-Position des Pyrimidin-Gerüsts der Formel I befindet.

Gleichermaßen werden des Weiteren Verbindungen der Formel I bevorzugt, worin Het wenigstens ein Ring-Schwefelatom aufweist. Hierunter sind solche Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, worin sich das Ring-Schwefelatom in der ortho-Position zu der Bindungsstelle von Het an die 5-Position des Pyrimidin-Gerüsts der Formel I befindet.

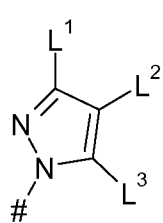
Gemäß einer ersten bevorzugten Ausführungsform der Erfindung steht Het für einen 5-gliedrigen heteroaromatischen Rest, der wenigstens ein Stickstoffatom und gegebenenfalls 1 oder 2 unter O, S und N ausgewählte weitere Heteroatome als Ringglieder aufweist. Beispiele hierfür sind Verbindungen der Formel I, worin Het ausgewählt ist unter Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1,2,4-Triazolyl, Oxazolyl, Thiazolyl,

Isoxazolyl und Isothiazolyl, wobei Het unsubstituiert ist oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L trägt.

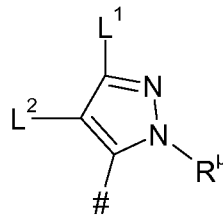
5 Unter den vorgenannten Verbindungen I sind solche besonders bevorzugt, worin Het für Thiazolyl, Imidazolyl, Pyrazolyl, 1,2,4-Triazolyl oder 1,2,3-Triazolyl steht, wobei die vorgenannten Reste unsubstituiert sind oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweisen. Ganz besonders bevorzugt werden solche Verbindungen I, worin Het für Pyrazol-1-yl steht, das unsubstituiert ist oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. Ganz besonders bevorzugt werden ebenfalls solche Verbindungen I, worin Het für Thiazol-2-yl steht, das unsubstituiert ist oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist.

10 In dieser Ausführungsform steht Het insbesondere für einen der nachfolgend angegebenen Reste Het-1 bis Het-31:

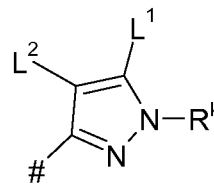
15



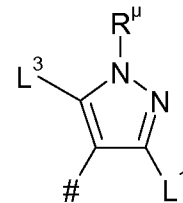
Het-1



Het-2

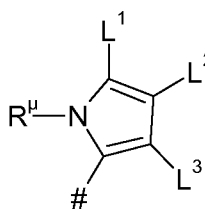


Het-3

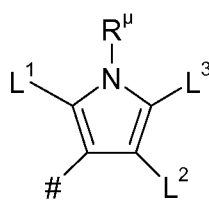


Het-4

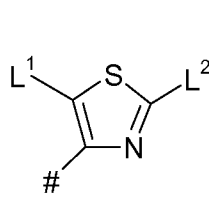
(R μ = C₁-C₄-Alkyl, insbesondere Methyl oder Ethyl)



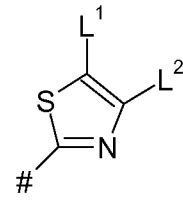
Het-5



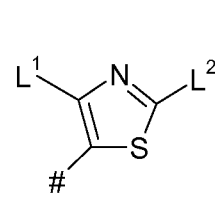
Het-6



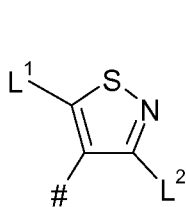
Het-7



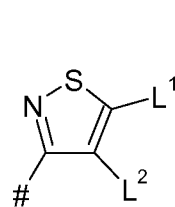
Het-8



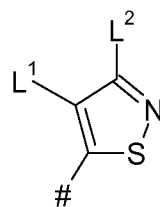
Het-9



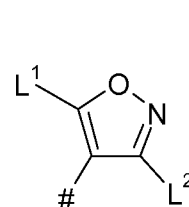
Het-10



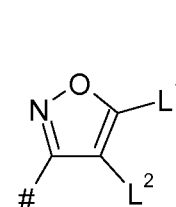
Het-11



Het-12



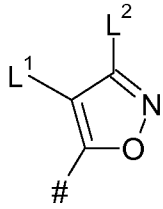
Het-13



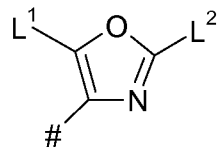
Het-14

20

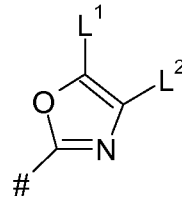
23



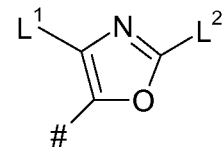
Het-15



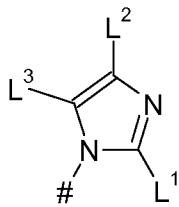
Het-16



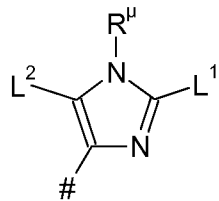
Het-17



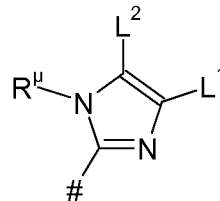
Het-18



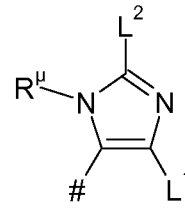
Het-19



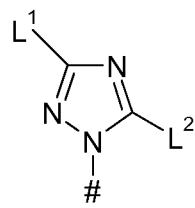
Het-20



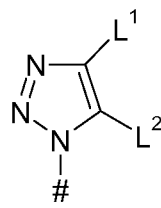
Het-21



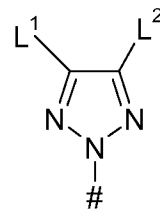
Het-22



Het-23

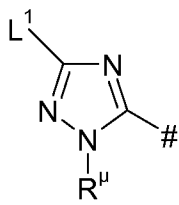


Het-24

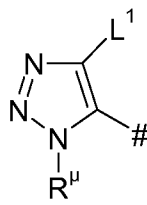


Het-25

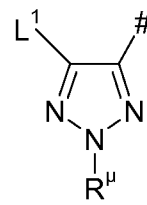
5



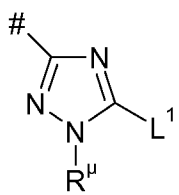
Het-26



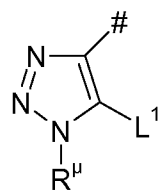
Het-27



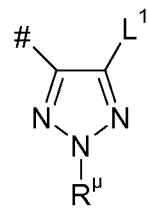
Het-28



Het-29



Het-30



Het-31

10

worin

R^μ für C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht;

die Anknüpfungsstelle an die 5-Position des Pyrimidinrings der Formel I bezeichnet; und

L1, L2 und L3 unabhängig voneinander für Wasserstoff stehen oder eine der für L genannten Bedeutungen aufweisen.

5

Vorzugsweise sind die Reste L¹, L² und L³ unabhängig voneinander ausgewählt unter Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, speziell C₁-C₂-Fluoralkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl. In besonders bevorzugten Ausführungsformen sind L¹, L² und L³ unabhängig voneinander ausgewählt unter Wasserstoff,

10

Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Isopropyl, Trifluormethyl, Fluormethyl, Methoxy und Methoxycarbonyl.

Beispiele für Het-1 sind 3,5-Dimethylpyrazol-1-yl, 3,5-Diisopropylpyrazol-1-yl, 3-Methyl-5-isopropyl-pyrazol-1-yl, 3-Isopropyl-5-methyl-pyrazol-1-yl, 3-Ethyl-5-methyl-pyrazol-1-yl, 3,4,5-Trimethyl-pyrazol-1-yl, 3-Chlor-pyrazol-1-yl, 3-Methyl-pyrazol-1-yl, 3-Methyl-4-chlor-pyrazol-1-yl, 3-Trifluormethyl-pyrazol-1-yl, 3-Trifluormethyl-5-methoxy-pyrazol-1-yl, 3-Trifluormethyl-5-methyl-pyrazol-1-yl, 3-Methyl-5-methoxypyrazol-1-yl, 3,5-Dichlor-4-methyl-pyrazol-1-yl, 3,5-Dimethyl-4-chlor-pyrazol-1-yl, 3,5-Ditri-fluormethyl-pyrazol-1-yl und 3,4-Dichlor-5-trichlormethylpyrazol.

20

Beispiele für Het-2 sind 1,3-Dimethylpyrazol-5-yl und 1-Methyl-3-trifluormethylpyrazol-5-yl.

Beispiele für Het-3 sind 1,5-Dimethylpyrazol-3-yl und 1-Methyl-5-methoxypyrazol-3-yl.

25

Beispiele für Het-4 umfassen 1,3-Dimethylpyrazol-4-yl, 1,5-Dimethylpyrazol-4-yl, 1,3,5-Trimethylpyrazol-4-yl, 1-Methyl-3-trifluormethylpyrazol-4-yl und 1-Methyl-5-trifluormethylpyrazol-4-yl.

30

Beispiele für Het-5 sind 1-Methyl-pyrrol-2-yl, 1,4-Dimethyl-pyrrol-2-yl, 1-Methyl-5-chlor-pyrrol-2-yl und 1-Methyl-3,5-dichlorpyrrol-2-yl.

Beispiel für Het-6 ist 1,4-Dimethylpyrrol-3-yl.

35

Beispiele für Het-7 umfassen Thiazol-4-yl, 2-Methyl-thiazol-4-yl, 2-Methyl-5-brom-thiazol-4-yl, 2-Methyl-5-chlor-thiazol-4-yl und 2,5-Dichlor-thiazol-4-yl.

Ein Beispiel für Het-8 ist Thiazol-2-yl.

Ein Beispiel für Het-9 ist Thiazol-5-yl.

Beispiele für Het-10 umfassen 3-Methyl-isothiazol-4-yl und 3-Methyl-5-chlor-isothiazol-4-yl.

5

Ein Beispiel für Het-11 ist Isothiazol-3-yl.

Ein Beispiel für Het-12 ist Isothiazol-5-yl.

10 Beispiele für Het-13 umfassen Isoxazol-4-yl, 3,5-Dimethyl-isoxazol-4-yl, 3-Methyl-isoxazol und 3-Chlor-isoxazol-4-yl.

Ein Beispiel für Het-14 ist Isoxazol-3-yl.

15 Ein Beispiel für Het-15 ist Isoxazol-5-yl.

Beispiele für Het-16 umfassen Oxazol-4-yl, 2-Methyl-oxazol-4-yl und 2,5-Dimethyloxazol-4-yl.

20 Ein Beispiel für Het-17 ist Oxazol-2-yl.

Ein Beispiel für Het-18 ist Oxazol-5-yl.

Beispiele für Het-19 umfassen 4,5-Dichlor-imidazol-1-yl und 4,5-Dimethyl-imidazol-1-yl.

25

Ein Beispiel für Het-20 ist 1-Methyl-imidazol-4-yl.

Ein Beispiel für Het-21 ist 1-Methylimidazol-2-yl.

30 Ein Beispiel für Het-22 ist 1-Methylimidazol-5-yl.

Beispiele für Het-23 umfassen 3-Chlor-1,2,4-triazol-1-yl, 3-Fluor-1,2,4-triazol-1-yl, 3-Brom-1,2,4-triazol-1-yl, 3-Trifluormethyl-1,2,4-triazol-1-yl, 3,5-Dimethyl-1,2,4-triazol-1-yl, 3,5-Dichlor-1,2,4-triazol-1-yl, 3,5-Dibrom-1,2,4-triazol-1-yl, 3,5-Difluor-1,2,4-triazol-1-yl und 3,5-Ditrifluormethyl-1,2,4-triazol-1-yl.

35

Beispiele für Het-24 umfassen 4,5-Dimethyl-1,2,3-triazol-1-yl, 4,5-Dichlor-1,2,3-triazol-1-yl, 4,5-Dibrom-1,2,3-triazol-1-yl, 4,5-Difluor-1,2,3-triazol-1-yl, 4,5-Ditrifluormethyl-

1,2,3-triazol-1-yl, 5-Methyl-1,2,3-triazol-1-yl, 5-Chlor-1,2,3-triazol-1-yl, 5-Fluor-1,2,3-triazol-1-yl, 5-Brom-1,2,3-triazol-1-yl und 5-Trifluormethyl-1,2,3-triazol-1-yl.

Ein Beispiel für Het-25 ist 1,2,3-Triazol-2-yl.

5

Ein Beispiel für Het-26 ist 1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl.

Ein Beispiel für Het-27 ist 1-Methyl-1,2,3-triazol-5-yl.

10 Ein Beispiel für Het-28 ist 2-Methyl-1,2,3-triazol-4-yl.

Ein Beispiel für Het-29 ist 1-Methyl-1,2,4-triazol-3-yl.

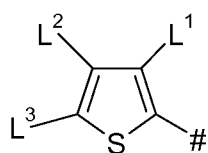
Ein Beispiel für Het-30 ist 1-Methyl-1,2,3-triazol-4-yl.

15

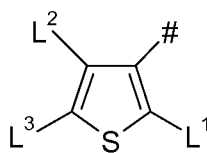
Ein Beispiel für Het-31 ist 2-Methyl-1,2,3-triazol-5-yl.

Gemäß einer weiteren bevorzugten Ausführungsform der Erfindung steht Het für Thienyl, das unsubstituiert ist oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. Dementsprechend steht Het für einen der folgenden Reste Het-32 oder Het-33, worin # die Anknüpfungsstelle zur 5-Position des Pyrimidin-Gerüsts der Formel I bezeichnet und L¹, L², und L³ unabhängig voneinander die zuvor für die Formeln Het-1 bis Het-31 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20



Het-32



Het-33

25

Beispiele für Het-32 sind 5-Methylthiophen-2-yl, 4-Methylthiophen-2-yl, 5-Chlorthiophen-2-yl, 3-Cyanothiophen-2-yl, 5-Acetylthiophen-2-yl, 5-Bromthiophen-2-yl, 3,5-Dichlorthiophen-2-yl, und 3,4,5-Trichlorthiophen-2-yl.

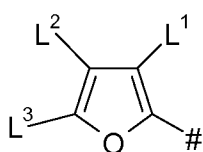
30

Beispiele für Het-33 sind 2-Methylthiophen-3-yl, 2,5-Dichlorthiophen-3-yl, 2,4,5-Trichlorthiophen-3-yl und 2,5-Dibromthiophen-3-yl.

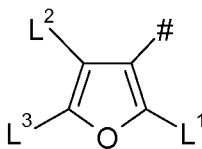
Vorzugsweise sind die Reste L¹, L² und L³ unabhängig voneinander ausgewählt unter den für Het-1 bis Het-31 als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

35

- Gemäß einer weiteren bevorzugten Ausführungsform der Erfindung steht Het für Furyl, das unsubstituiert ist oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. Dementsprechend steht Het für einen der folgenden Reste Het-34 oder Het-35, worin # die Anknüpfungsstelle bezeichnet und L¹, L², und L³ unabhängig voneinander die zuvor für die Formeln Het-1 bis Het-31 angegebenen Bedeutungen aufweisen.



Het-34



Het-35

- Beispiele für Het-34 sind 2-Furyl, 5-Methylfuran-2-yl, 5-Chlorfuran-2-yl, 4-Methylfuran-2-yl, 3-Cyanofuran-2-yl, 5-Acetylfuran-2-yl, 5-Bromfuran-2-yl, 3,5-Dichlorfuran-2-yl, 3,4,5-Trichlorfuran-2-yl und 5-Bromfuran-2-yl.

- Beispiele für Het-35 sind 3-Furyl, 2-Methylfuran-3-yl, 2,5-Dimethylfuran-3-yl und 2,5-Dibromfuran-3-yl.

Vorzugsweise sind die Reste L¹, L² und L³ unabhängig voneinander ausgewählt unter den für Het-1 bis Het-31 als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

- Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin Het für einen 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest steht, der wenigstens ein Stickstoffatom und gegebenenfalls 1 oder 2 unter O, S und N ausgewählte weitere Heteroatome als Ringglieder aufweist. Beispiele hierfür sind Verbindungen der Formel I, worin Het ausgewählt ist unter Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl oder Triazinyl, insbesondere für Pyridinyl, oder Pyrimidinyl, wobei Het unsubstituiert ist oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L trägt. In dieser Ausführungsform steht Het insbesondere für einen 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest, der 1, 2 oder 3 Stickstoffatome als Ringglieder aufweist und der unsubstituiert ist oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L trägt.

30

- Unter den Verbindungen dieser Ausführungsform sind Verbindungen der allgemeinen Formel I besonders bevorzugt, worin Het für Pyridinyl steht, das unsubstituiert ist oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L trägt. Hierunter ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, worin Het für Pyridin-2-yl steht, das 1 oder 2 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. Hierunter sind solche Verbin-

35

dungen speziell bevorzugt, worin einer der Substituenten L in der 5-Position des Pyridinylrings angeordnet ist. Gleichermäßen sind hierunter Verbindungen I speziell bevorzugt, worin einer der Substituenten L in der 3-Position des Pyridinylrings angeordnet ist. L hat hierbei ganz speziell die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

5

Unter den Verbindungen dieser Ausführungsform sind weiterhin Verbindungen der allgemeinen Formel I besonders bevorzugt, worin Het für Pyridin-3-yl steht, das gegebenenfalls 1 oder 2 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. Hierunter sind solche Verbindungen ganz besonders bevorzugt, die einen Substituenten L in der
10 2-Position und/oder einen Substituenten L in der 4-Position des Pyridinrings aufweisen. L hat hierbei insbesondere die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

Unter den Verbindungen dieser Ausführungsform sind weiterhin Verbindungen der allgemeinen Formel I besonders bevorzugt, worin Het für Pyridin-4-yl steht, das gegebenenfalls 1 oder 2 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. Hierunter sind
15 solche Verbindungen ganz besonders bevorzugt, die einen Substituenten L in der 3-Position und/oder einen Substituenten L in der 5-Position des Pyridinrings aufweisen. L hat hierbei insbesondere die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

20 Unter den Verbindungen dieser Ausführungsform sind weiterhin Verbindungen der allgemeinen Formel I besonders bevorzugt, worin Het für Pyrimidinyl, insbesondere für 2- oder 4-Pyrimidinyl steht, das jeweils 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. Hierunter ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, worin Het für Pyrimidin-2-yl oder Pyrimidin-4-yl steht, das 1 oder 2 gleiche oder ver-
25 schiedene Substituenten L aufweist. Hierunter sind solche Verbindungen speziell bevorzugt, worin einer der Substituenten L in der 5-Position des Pyrimidinylrings angeordnet ist. L hat hierbei ganz speziell die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

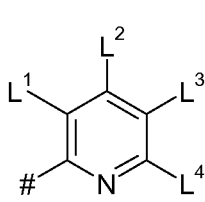
30 Unter den Verbindungen dieser Ausführungsform sind weiterhin Verbindungen der allgemeinen Formel I besonders bevorzugt, worin Het für Pyrazin-2-yl steht, das 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. L hat hierbei insbesondere die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

35 Unter den Verbindungen dieser Ausführungsform sind weiterhin Verbindungen der allgemeinen Formel I besonders bevorzugt, worin Het für Pyridazin-4-yl steht, das 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. L hat hierbei insbesondere die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

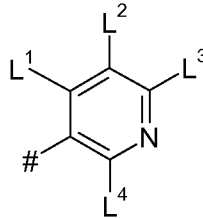
Unter den Verbindungen dieser Ausführungsform sind weiterhin Verbindungen der allgemeinen Formel I besonders bevorzugt, worin Het für 1,3,5-Triazinyl steht, das 1 oder 2 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist. L hat hierbei insbesondere die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

5

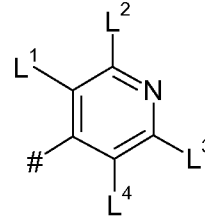
Beispiele für speziell bevorzugte heterocyclische Reste Het dieser Ausführungsform sind die im Folgenden angegebenen Reste Het-36 bis Het-41:



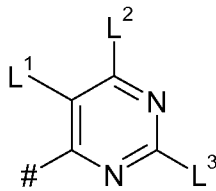
Het-36



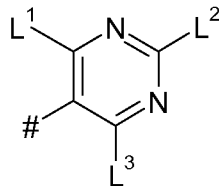
Het-37



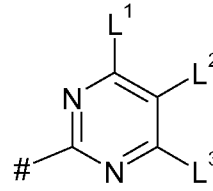
Het-38



Het-39



Het-40



Het-41

10

worin

- # die Anknüpfungsstelle an die 5-Position des Pyrimidinrings der Formel I bezeichnet; und
- 15 L^1 , L^2 , L^3 und L^4 unabhängig voneinander für Wasserstoff stehen oder eine der für L genannten Bedeutungen aufweisen.

- Beispiele für Het-36 sind 3-Fluor-pyridin-2-yl, 3-Chlor-pyridin-2-yl,
- 20 3-Brom-2-pyridin-2-yl, 3-Trifluormethyl-pyridin-2-yl, 3-Methyl-pyridin-2-yl, 3-Ethyl-pyridin-2-yl, 3,5-Difluor-pyridin-2-yl, 3,5-Dichlor-pyridin-2-yl, 3,5-Dibrom-pyridin-2-yl, 3,5-Dimethyl-pyridin-2-yl, 3-Fluor-5-trifluormethyl-pyridin-2-yl, 3-Chlor-5-fluor-pyridin-2-yl, 3-Chlor-5-methyl-pyridin-2-yl, 3-Fluor-5-chlor-pyridin-2-yl, 3-Fluor-5-methyl-pyridin-2-yl, 3-Methyl-5-fluor-pyridin-2-yl, 3-Methyl-5-chlor-pyridin-2-yl,
- 25 5-Nitro-pyridin-2-yl, 5-Cyano-pyridin-2-yl, 5-Methoxycarbonyl-pyridin-2-yl, 5-Trifluormethyl-pyridin-2-yl, 5-Methyl-pyridin-2-yl, 4-Methyl-pyridin-2-yl, 6-Ethoxypyridin-2-yl, 6-Methoxypyridin-2-yl, 6-Methylsulfanylpyridin-2-yl, Ethylsulfanylpyridin-2-yl und 6-Methyl-pyridin-2-yl.

Beispiele für Het-37 sind 2-Chlor-pyridin-3-yl, 2-Brom-pyridin-3-yl, 2-Fluorpyridin-3-yl, 2-Methyl-pyridin-3-yl, 2,4-Dichlor-pyridin-3-yl, 2,4-Dibrom-pyridin-3-yl, 2,4-Difluorpyridin-3-yl, 2-Fluor-4-chlorpyridin-3-yl, 2-Chlor-4-fluor-pyridin-3-yl, 2-Chlor-4-methyl-pyridin-3-yl, 2-Methyl-4-fluor-pyridin-3-yl, 2-Methyl-4-chlor-pyridin-3-yl,
5 2,4-Dimethyl-pyridin-3-yl, 2,4,6-Trichlorpyridin-3-yl, 2,4,6-Tribrompyridin-3-yl, 2,4,6-Trimethyl-pyridin-3-yl, 2-Chlor-6-methylpyridin-3-yl, 2-Fluor-6-methylpyridin-3-yl und 2,4-Dichlor-6-methylpyridin-3-yl.

Beispiele für Het-38 umfassen 3-Chlor-pyridin-4-yl, 3-Brom-pyridin-4-yl,
10 3-Methyl-pyridin-4-yl, 3,5-Dichlor-pyridin-4-yl, 3,5-Dibrom-pyridin-4-yl und 3,5-Dimethyl-pyridin-4-yl.

Beispiele für Het-39 umfassen 5-Chlorpyrimidin-4-yl, 5-Fluorpyrimidin-4-yl,
5-Fluor-6-chlorpyrimidin-4-yl, 2-Methyl-6-trifluormethyl-pyrimidin-4-yl,
15 2,5-Dimethyl-6-trifluormethyl-pyrimidin-4-yl, 5-Methyl-6-trifluormethyl-pyrimidin-4-yl, 6-Trifluormethyl-pyrimidin-4-yl, 2-Methyl-5-fluor-pyrimidin-4-yl, 2-Methyl-5-chlor-pyrimidin-4-yl, 5-Chlor-6-methyl-pyrimidin-4-yl, 5-Chlor-6-ethyl-pyrimidin-4-yl, 5-Chlor-6-isopropyl-pyrimidin-4-yl, 5-Brom-6-methyl-pyrimidin-4-yl, 5-Fluor-6-methyl-pyrimidin-4-yl,
20 5-Fluor-6-fluormethyl-pyrimidin-4-yl, 2,6-Dimethyl-5-chlor-pyrimidin-4-yl, 5,6-Dimethyl-pyrimidin-4-yl, 2,5-Dimethyl-pyrimidin-4-yl, 2,5,6-Trimethyl-pyrimidin-4-yl und 5-Methyl-6-methoxy-pyrimidin-4-yl.

Beispiele für Het-40 umfassen 4-Methyl-pyrimidin-5-yl, 4,6-Dimethyl-pyrimidin-5-yl,
25 2,4,6-Trimethylpyrimidin-5-yl und 4-Trifluormethyl-6-methyl-pyrimidin-5-yl.

Beispiele für Het-41 umfassen 4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl, 4,5,6-Trimethylpyrimidin-2-yl, 4,6-Ditrifluormethyl-pyrimidin-2-yl und 4,6-Dimethyl-5-chlor-pyrimidin-2-yl.

30 Vorzugsweise sind die Reste L¹, L², L³ und L⁴ unabhängig voneinander ausgewählt unter Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, speziell C₁-C₂-Fluoralkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl. Insbesondere sind L¹, L², L³ und L⁴ unabhängig voneinander ausgewählt unter Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Isopropyl, Trifluormethyl, Fluormethyl, Methoxy und Methoxy-carbonyl.
35

Im Übrigen stehen R⁵, R⁶, R⁵⁵, R⁶⁶, R^{55a} und R^{66a} unabhängig voneinander vorzugsweise für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.

R⁷, R⁷⁷ stehen unabhängig voneinander vorzugsweise für Wasserstoff oder insbesondere für C₁-C₆-Alkyl.

5 R⁸, R⁸⁸, R⁹ und R⁹⁹ stehen unabhängig voneinander vorzugsweise für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl.

R¹⁰, R^{10a}, R¹¹ und R^{11a} sind unabhängig voneinander vorzugsweise ausgewählt unter Wasserstoff und C₁-C₆-Alkyl.

10 Des Weiteren stehen B¹, C¹ unabhängig voneinander vorzugsweise für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder Amino.

B², C² stehen unabhängig voneinander vorzugsweise für C₁-C₄-Alkoxy, NH₂, C₁-C₄-Alkylamino oder Di-C₁-C₄-alkylamino.

15

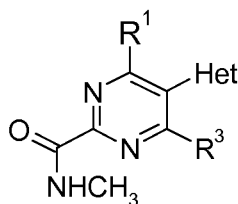
Z steht vorzugsweise für O, S oder NOR³⁴.

Z' steht vorzugsweise für eine direkte Bindung.

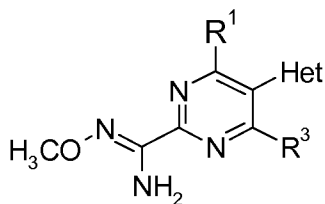
20 R²¹, R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R²⁸, R²⁹, R³⁰, R³¹, R³², R³³, R³⁴, R³⁵ und R³⁶ stehen unabhängig voneinander vorzugsweise für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.

R²² steht vorzugsweise für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, -CO-OR²¹ oder -COR²⁵.

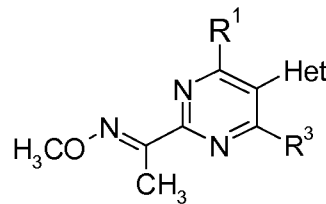
25 Insbesondere sind die folgenden Gruppen von Verbindungen der im Folgenden angegebenen Formeln I.1 bis 1.18 bevorzugt:



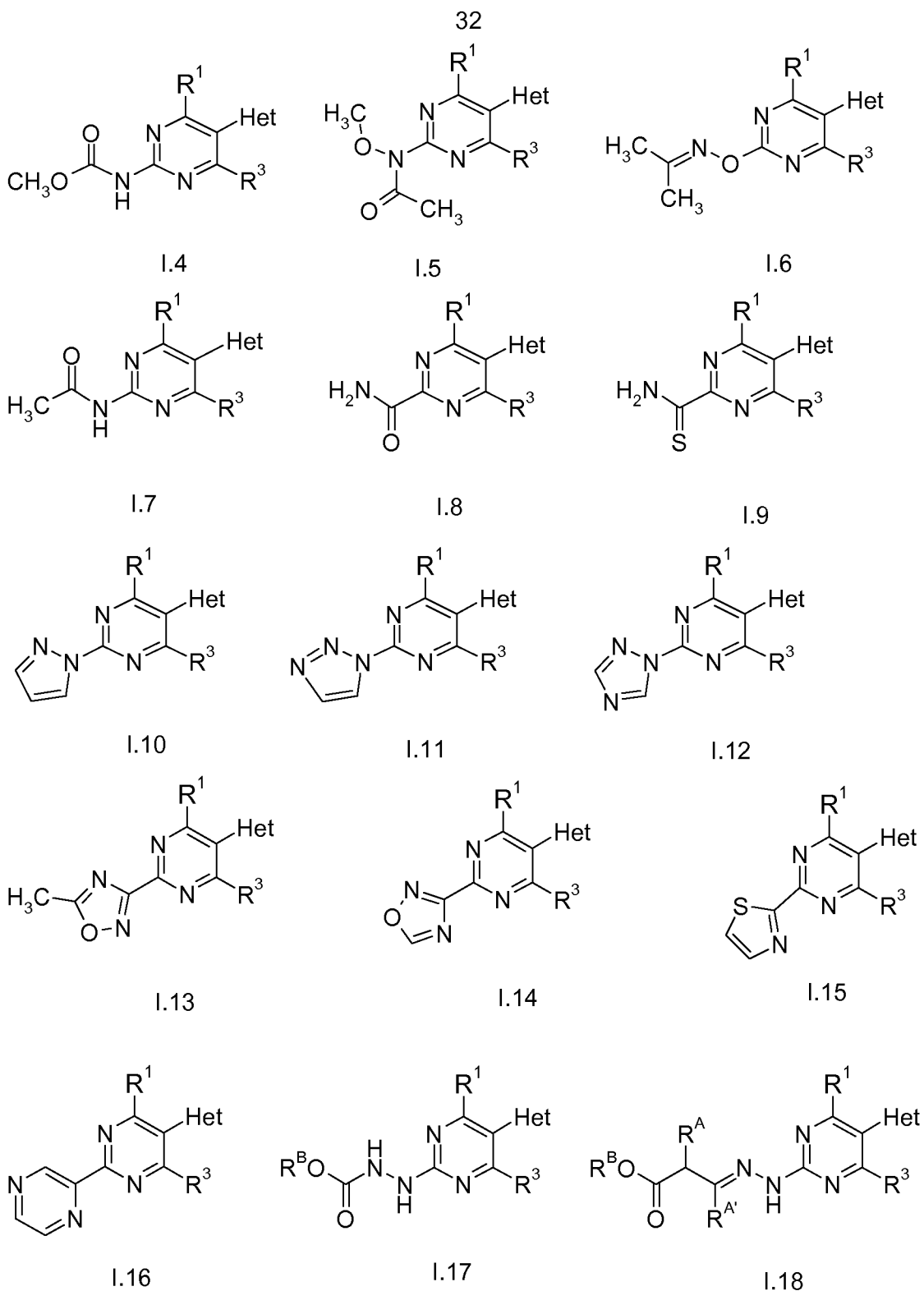
I.1



I.2



I.3



In den Formeln I.1 bis 1.18 haben Het, R1 und R3 die zuvor genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen. In den Formeln I.17 und I.18 steht R^B für C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl, und R^A und R^{A'} bedeuten unabhängig voneinander C₁-C₄-Alkyl, insbesondere Methyl.

10

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen 1 bis 462 zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen 1 bis 462 für einen Substituenten Het genannten Reste stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methyl-5-isopropylpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 2

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dimethylpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 3

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Isopropyl-5-methylpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 4

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Ethyl-5-methylpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 5

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methyl-5-methoxypyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 6

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,4,5-Trimethylpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

spricht.

Tabelle 7

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dimethyl-4-chlorpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 8

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Chlorpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 9

15 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,4-Dichlor-5-trichlormethylpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20 Tabelle 10

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methylpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 11

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dichlor-4-methylpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 12

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methyl-4-chlorpyrazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 13

40 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1,3-Dimethylpyrazol-5-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

spricht.

Tabelle 14

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1-Methyl-3-trifluormethylpyrazol-5-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 15

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1,5-Dimethylpyrazol-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15 Tabelle 16

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1-Methyl-5-methoxypyrazol-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 17

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1,3,5-Trimethylpyrazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 18

30 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1-Methyl-3-trifluormethylpyrazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 19

35 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, Wasserstoff und Het 1,3-Dimethylpyrazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 20

40 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1-Methyl-5-trifluormethylpyrazol-4-yl be-

deutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 21

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1,5-Dimethylpyrazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10 Tabelle 22

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1-Methylpyrrol-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15 Tabelle 23

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1,4-Dimethylpyrrol-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 24

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1-Methyl-5-chlor-pyrrol-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 25

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 1-Methyl-3,5-dichlorpyrrol-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 26

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methylthiazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 27

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het Thiazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl

40

steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 28

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methyl-5-chlorthiazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 29

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,5-Dichlorthiazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15 Tabelle 30

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methyl-5-brom-thiazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 31

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methylisothiazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 32

30 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methyl-5-chlorisothiazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 33

35 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dimethylisoxazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 34

40 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Chlorisoxazol-4-yl bedeutet, R³ für

Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 35

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methylisoxazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10 Tabelle 36

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,5-Dimethyloxazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 37

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methyloxazol-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 38

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,5-Dichlorimidazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 39

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,5-Dimethylimidazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 40

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dimethyl-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 41

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dichlor-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet,

40

R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 42

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dibrom-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10 Tabelle 43

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Difluor-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 44

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Ditrifluormethyl-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 45

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methyl-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 46

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Chlor-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 47

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Fluor-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

40 Tabelle 48

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13,

I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Brom-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

5 Tabelle 49

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Trifluormethyl-1,2,4-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10

Tabelle 50

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,5-Dimethyl-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 51

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,5-Dichlor-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 52

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,5-Dibrom-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 53

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,5-Difluor-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

35 Tabelle 54

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,5-Ditrifluormethyl-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

40

Tabelle 55

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Methyl-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 56

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Chlor-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 57

15 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Fluor-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 58

20 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Brom-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25 Tabelle 59

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Trifluormethyl-1,2,3-triazol-1-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 60

35 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dichlorthiophen-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 61

40 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,4,5-Trichlorthiophen-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-

spricht.

Tabelle 62

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Chlorthiophen-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 63

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Bromthiophen-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15 Tabelle 64

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Methylthiophen-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 65

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,5-Dichlorthiophen-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 66

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,5-Dibromthiophen-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 67

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methylthiophen-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 68

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4-Methylthiophen-2-yl bedeutet, R³ für

40

Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 69

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Cyanothiophen-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10 Tabelle 70

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Acetylthiophen-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 71

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4-Methylfuran-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 72

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Cyanofuran-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 73

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Acetylfuran-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 74

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Chlorpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 75

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Brompyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

40

Tabelle 76

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dibrompyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 77

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dimethylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 78

15 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Nitropyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 79

20 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Cyanopyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 80

25 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Methoxycarbonylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 81

30 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Methylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 82

35 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4-Methylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 83

40 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Me-

thyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 84

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Ethylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 85

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 6-Methylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 86

15 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Trifluormethylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 87

20 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Trifluormethylpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25 Tabelle 88

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Fluorpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30 Tabelle 89

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Fluorpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35 Tabelle 90

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Difluorpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

40

Tabelle 91

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dichlorpyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

5

Tabelle 92

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Fluor-5-methyl-pyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10

Tabelle 93

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Fluor-5-chlor-pyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 94

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Chlor-5-fluor-pyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 95

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Chlor-5-methyl-pyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

30

Tabelle 96

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methyl-5-chlor-pyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 97

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methyl-5-fluor-pyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

40

entspricht.

Tabelle 98

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 6-Methoxypyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 99

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 6-Ethoxypyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15 Tabelle 100

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 6-Methylthiopyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 101

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 6-Ethylthiopyridin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 102

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Chlorpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 103

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4-Dichlorpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 104

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4,6-Trichlorpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

40

spricht.

Tabelle 105

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Brompyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 106

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4-Dibrompyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 107

15 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4,6-Tribrompyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20 Tabelle 108

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methylpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25 Tabelle 109

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4-Dimethylpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 110

35 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4,6-Trimethylpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 111

40 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4-Dichlor-6-methylpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

entspricht.

Tabelle 112

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4-Difluorpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 113

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Fluor-4-chlorpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15 Tabelle 114

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Chlor-4-fluor-pyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 115

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Chlor-4-methylpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 116

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methyl-4-chlorpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 117

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methyl-4-fluorpyridin-3-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 118

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Chlor-6-methylpyridin-3-yl bedeutet,

40

R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 119

- 5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Fluorpyridin-3-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 120

- 10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Fluor-6-methylpyridin-3-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15 Tabelle 121

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Chlorpyridin-4-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20 Tabelle 122

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dichlorpyridin-4-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 123

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Brompyridin-4-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 124

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dibrompyridin-4-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 125

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3-Methylpyridin-4-yl bedeutet, R^3 für Methyl steht, und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

40

Tabelle 126

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 3,5-Dimethylpyridin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 127

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Chlorpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 128

15 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Fluorpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 129

20 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methyl-6-trifluormethylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25 Tabelle 130

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,5-Dimethyl-6-trifluormethylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 131

35 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Methyl-6-trifluormethylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 132

40 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 6-Trifluormethylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

entspricht.

Tabelle 133

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Chlor-6-ethylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 134

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Chlor-6-methylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15 Tabelle 135

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Chlor-6-isopropylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 136

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Fluor-6-chlorpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 137

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Brom-6-methylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 138

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Fluor-6-methylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 139

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Fluor-6-fluormethylpyrimidin-4-yl be-

40

deutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 140

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,6-Dimethyl-5-chlorpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10 Tabelle 141

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5,6-Dimethylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 142

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,5-Dimethylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 143

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,5,6-Trimethylpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 144

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 5-Methyl-6-methoxypyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 145

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methyl-5-chlorpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

40 Tabelle 146

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13,

I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2-Methyl-5-fluorpyrimidin-4-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

5 Tabelle 147

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4-Methylpyrimidin-5-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10

Tabelle 148

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,6-Dimethylpyrimidin-5-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 149

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4-Trifluormethyl-6-methylpyrimidin-5-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 150

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 2,4,6-Trimethylpyrimidin-5-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 151

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

35 Tabelle 152

Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,5,6-Trimethylpyrimidin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

40

Tabelle 153

5 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,6-Ditrifluormethylpyrimidin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 154

10 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het 4,6-Dimethyl-5-chlorpyrimidin-2-yl bedeutet, R³ für Methyl steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabellen 155 bis 308

15 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het jeweils für einen der in den Tabellen 1 bis 154 angegebenen Reste steht, R³ für Chlor steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabellen 309 bis 462

20 Verbindungen der Formeln I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6, I.7, I.8, I.9, I.10, I.11, I.12, I.13, I.14, I.15, I.16, I.17 und I.18, in denen Het jeweils für einen der in den Tabellen 1 bis 154 angegebenen Reste steht, R³ für Cyano steht, und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25 Tabelle A

Nr.	R ¹
A-1	CH ₃
A-2	CH ₂ CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-4	CH(CH ₃) ₂
A-5	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-6	(±) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-7	(R) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-8	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-9	(CH ₂) ₃ CH ₃
A-10	C(CH ₃) ₃
A-11	(CH ₂) ₄ CH ₃
A-12	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
A-13	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂

A-14	(±) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
A-15	(R) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
A-16	(S) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
A-17	(±) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-18	(R) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-19	(S) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-20	(±) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
A-21	(R) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
A-22	(S) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
A-23	(CH ₂) ₅ CH ₃
A-24	(±,±) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-25	(±,R) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-26	(±,S) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-27	(±) CH ₂ CH(CH ₃)CF ₃
A-28	(R) CH ₂ CH(CH ₃)CF ₃
A-29	(S) CH ₂ CH(CH ₃)CF ₃
A-30	(±) CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
A-31	(R) CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
A-32	(S) CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
A-33	(±,±) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
A-34	(±,R) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
A-35	(±,S) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
A-36	(±,±) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
A-37	(±,R) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
A-38	(±,S) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
A-39	CF ₃
A-40	CF ₂ CF ₃
A-41	CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-42	c-C ₃ H ₅
A-43	(1-CH ₃)-c-C ₃ H ₄
A-44	c-C ₅ H ₉
A-45	c-C ₆ H ₁₁
A-46	(4-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀
A-47	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
A-48	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
A-49	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
A-50	CH ₂ -Si(CH ₃) ₃
A-51	n-C ₆ H ₁₃
A-52	(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂

A-53	$(\text{CH}_2)_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$
A-54	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
A-55	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_4\text{H}_9$
A-56	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
A-57	$\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
A-58	$\text{CH}_2\text{-c-C}_5\text{H}_9$
A-59	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
A-60	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-61	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$
A-62	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
A-63	$(\text{CH}_2)_2\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
A-64	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2\text{-C}_2\text{H}_5$
A-65	$2\text{-CH}_3\text{-c-C}_5\text{H}_8$
A-66	$3\text{-CH}_3\text{-c-C}_5\text{H}_8$
A-67	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-n-C}_3\text{H}_7$
A-68	$(\text{CH}_2)_6\text{-CH}_3$
A-69	$(\text{CH}_2)_4\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
A-70	$(\text{CH}_2)_3\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$
A-71	$(\text{CH}_2)_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
A-72	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_4\text{H}_9$
A-73	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_5\text{H}_{11}$
A-74	$(\text{CH}_2)_3\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-75	$(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
A-76	$(\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-77	$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
A-78	$(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}_2\text{H}_5$
A-79	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$
A-80	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$
A-81	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-n-C}_3\text{H}_7$
A-82	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
A-83	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-n-C}_4\text{H}_9$
A-84	$(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
A-85	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
A-86	$\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{-n-C}_4\text{H}_9$
A-87	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-88	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-89	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-90	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-91	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$

A-92	$C(CH_3)_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-93	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
A-94	$CH(CH_3)C(CH_3)_2C_2H_5$
A-95	$CH(CH_3)CH(C_2H_5)_2$
A-96	$C(CH_3)_2CH(CH_3)C_2H_5$
A-97	$CH(C_2H_5)CH(CH_3)C_2H_5$
A-98	$C(CH_3)(C_2H_5)-n-C_3H_7$
A-99	$CH(n-C_3H_7)_2$
A-100	$CH(n-C_3H_7)CH(CH_3)_2$
A-101	$C(CH_3)_2C(CH_3)_3$
A-102	$C(CH_3)(C_2H_5)-CH(CH_3)_2$
A-103	$C(C_2H_5)_3$
A-104	$(3-CH_3)-c-C_6H_{10}$
A-105	$(2-CH_3)-c-C_6H_{10}$
A-106	$n-C_8H_{17}$
A-107	$CH_2C(=NO-CH_3)CH_3$
A-108	$CH_2C(=NO-C_2H_5)CH_3$
A-109	$CH_2C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
A-110	$CH_2C(=NO-i-C_3H_7)CH_3$
A-111	$CH(CH_3)C(=NOCH_3)CH_3$
A-112	$CH(CH_3)C(=NOC_2H_5)CH_3$
A-113	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
A-114	$CH(CH_3)C(=NO-i-C_3H_7)CH_3$
A-115	$C(=NOCH_3)C(=NOCH_3)CH_3$
A-116	$C(=NOCH_3)C(=NOC_2H_5)CH_3$
A-117	$C(=NOCH_3)C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
A-118	$C(=NOCH_3)C(=NO-i-C_3H_7)CH_3$
A-119	$C(=NOC_2H_5)C(=NOCH_3)CH_3$
A-120	$C(=NOC_2H_5)C(=NOC_2H_5)CH_3$
A-121	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
A-122	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-i-C_3H_7)CH_3$
A-123	$CH_2C(=NO-CH_3)C_2H_5$
A-124	$CH_2C(=NO-C_2H_5)C_2H_5$
A-125	$CH_2C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
A-126	$CH_2C(=NO-i-C_3H_7)C_2H_5$
A-127	$CH(CH_3)C(=NOCH_3)C_2H_5$
A-128	$CH(CH_3)C(=NOC_2H_5)C_2H_5$
A-129	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
A-130	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$

A-131	$C(=NOCH_3)C(=NOCH_3)C_2H_5$
A-132	$C(=NOCH_3)C(=NOC_2H_5)C_2H_5$
A-133	$C(=NOCH_3)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
A-134	$C(=NOCH_3)C(=NO-i-C_3H_7)C_2H_5$
A-135	$C(=NOC_2H_5)C(=NOCH_3)C_2H_5$
A-136	$C(=NOC_2H_5)C(=NOC_2H_5)C_2H_5$
A-137	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
A-138	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-i-C_3H_7)C_2H_5$
A-139	$CH=CH-CH_2CH_3$
A-140	$CH_2-CH=CH-CH_3$
A-141	$CH_2-CH_2-CH=CH_2$
A-142	$C(CH_3)_2CH_2CH_3$
A-143	$CH=C(CH_3)_2$
A-144	$C(=CH_2)-CH_2CH_3$
A-145	$C(CH_3)=CH-CH_3$
A-146	$CH(CH_3)CH=CH_2$
A-147	$CH=CH-n-C_3H_7$
A-148	$CH_2-CH=CH-C_2H_5$
A-149	$(CH_2)_2-CH=CH-CH_3$
A-150	$(CH_2)_3-CH=CH_2$
A-151	$CH=CH-CH(CH_3)_2$
A-152	$CH_2-CH=C(CH_3)_2$
A-153	$(CH_2)_2-C(CH_3)=CH_2$
A-154	$CH=C(CH_3)-C_2H_5$
A-155	$CH_2-C(=CH_2)-C_2H_5$
A-156	$CH_2-C(CH_3)=CH-CH_3$
A-157	$CH_2-CH(CH_3)-CH=CH_2$
A-158	$C(=CH_2)-CH_2-CH_2-CH_3$
A-159	$C(CH_3)=CH-CH_2-CH_3$
A-160	$CH(CH_3)-CH=CH-CH_3$
A-161	$CH(CH_3)-CH_2-CH=CH_2$
A-162	$C(=CH_2)CH(CH_3)_2$
A-163	$C(CH_3)=C(CH_3)_2$
A-164	$CH(CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
A-165	$C(CH_3)_2-CH=CH_2$
A-166	$C(C_2H_5)=CH-CH_3$
A-167	$CH(C_2H_5)-CH=CH_2$
A-168	$CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_3$
A-169	$CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_3$

A-170	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-171	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
A-172	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
A-173	$\text{CH=CH-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)CH}_3$
A-174	$\text{CH}_2\text{-CH=CH-CH(CH}_3\text{)CH}_3$
A-175	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=C(CH}_3\text{)CH}_3$
A-176	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=CH}_2$
A-177	$\text{CH=CH-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
A-178	$\text{CH}_2\text{-CH=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
A-179	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
A-180	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_3$
A-181	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH=CH}_2$
A-182	$\text{CH=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-183	$\text{CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-184	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-185	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_3$
A-186	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
A-187	$\text{C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-188	$\text{C(CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-189	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-190	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
A-191	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
A-192	$\text{CH=CH-C(CH}_3\text{)}_3$
A-193	$\text{CH=C(CH}_3\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
A-194	$\text{CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
A-195	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=C(CH}_3\text{)-CH}_3$
A-196	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-C(=CH}_2\text{)-CH}_3$
A-197	$\text{C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
A-198	$\text{C(CH}_3\text{)=CH-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
A-199	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH=C(CH}_3\text{)-CH}_3$
A-200	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_3$
A-201	$\text{CH=C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
A-202	$\text{CH}_2\text{-C(=CH-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
A-203	$\text{CH}_2\text{-CH(CH=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
A-204	$\text{C(=CH-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-205	$\text{CH(CH=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-206	$\text{C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-207	$\text{CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_3$
A-208	$\text{CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH=CH}_2$

A-209	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
A-210	$\text{C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-211	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-212	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-213	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_3$
A-214	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}=\text{CH}_2$
A-215	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_3$
A-216	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
A-217	$\text{C}(\text{=CH}_2)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
A-218	$\text{C}(\text{=CH-CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
A-219	$\text{CH}(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
A-220	$\text{C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
A-221	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3$
A-222	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3$
A-223	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-224	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-225	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-226	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
A-227	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
A-228	$\text{C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
A-229	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
A-230	$\text{CH}(\text{CH}(\text{CH}_3)_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
A-231	$\text{CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-232	$\text{CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-233	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-234	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-235	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_3$
A-236	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
A-237	$\text{CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
A-238	$\text{CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
A-239	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
A-240	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
A-241	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3$
A-242	$\text{CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-243	$\text{CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-244	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-245	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-246	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_3$
A-247	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}=\text{CH}_2$

A-248	$\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-249	$\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-250	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-251	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-252	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-253	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-254	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-255	$\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-256	$\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-257	$\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-258	$\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-259	$\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-260	$\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-261	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-262	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-263	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-264	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-265	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-266	$\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-267	$\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-268	$\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-269	$\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-270	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-271	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-272	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_3$
A-273	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-274	$\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-275	$\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-276	$\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-277	$\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_3$
A-278	$\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-279	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-280	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-281	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-282	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_3$
A-283	$\text{CH}=\text{CH}-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-284	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-285	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-286	$\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$

A-287	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-288	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-289	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_3$
A-290	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH=CH}_2$
A-291	$\text{C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-292	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-293	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH=C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-294	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-295	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_3$
A-296	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH=CH}_2$
A-297	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH=CH-CH}_3$
A-298	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
A-299	$\text{C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-300	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-301	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-302	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-303	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH=CH-CH}_3$
A-304	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
A-305	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-306	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
A-307	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
A-308	$\text{CH=CH-CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-309	$\text{CH}_2\text{-CH=C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-310	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{=CH-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-311	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-312	$\text{CH=C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-313	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{=CH-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-314	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-315	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-316	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH=CH-CH}_3$
A-317	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH-CH=CH}_2$
A-318	$\text{C}(\text{=CH-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-319	$\text{CH}(\text{CH=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-320	$\text{C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-321	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
A-322	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
A-323	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
A-324	$\text{C}(\text{=CH-CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
A-325	$\text{C}(\text{CH=CH-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$

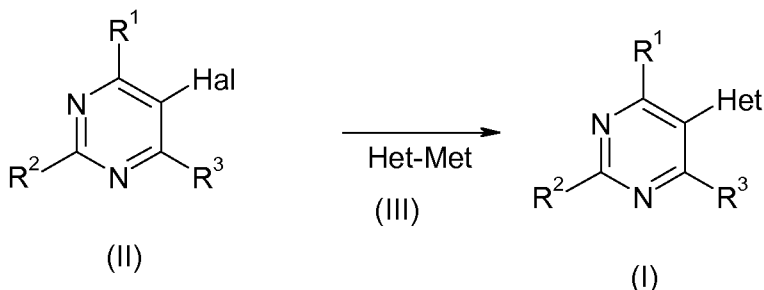
A-326	$C(CH_2-CH=CH_2)-CH_2-CH_2-CH_3$
A-327	$CH=C(CH_3)-C(CH_3)_3$
A-328	$CH_2-C(=CH_2)-C(CH_3)_3$
A-329	$CH_2-C(CH_3)_2-CH(=CH_2)-CH_3$
A-330	$C(=CH_2)-CH(CH_3)-CH(CH_3)-CH_3$
A-331	$C(CH_3)=C(CH_3)-CH(CH_3)-CH_3$
A-332	$CH(CH_3)-C(=CH_2)-CH(CH_3)-CH_3$
A-333	$CH(CH_3)-C(CH_3)=C(CH_3)-CH_3$
A-334	$CH(CH_3)-CH(CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
A-335	$C(CH_3)_2-CH=C(CH_3)-CH_3$
A-336	$C(CH_3)_2-CH_2-C(=CH_2)-CH_3$
A-337	$C(CH_3)_2-C(=CH_2)-CH_2-CH_3$
A-338	$C(CH_3)_2-C(CH_3)=CH-CH_3$
A-339	$C(CH_3)_2-CH(CH_3)CH=CH_2$
A-340	$CH(CH_2-CH_3)-CH_2-CH(CH_3)-CH_3$
A-341	$CH(CH_2-CH_3)-CH(CH_3)-CH_2-CH_3$
A-342	$C(CH_3)(CH_2-CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$
A-343	$CH(i-C_3H_7)-CH_2-CH_2-CH_3$
A-344	$CH=C(CH_2-CH_3)-CH(CH_3)-CH_3$
A-345	$CH_2-C(=CH-CH_3)-CH(CH_3)-CH_3$
A-346	$CH_2-CH(CH=CH_2)-CH(CH_3)-CH_3$
A-347	$CH_2-C(CH_2-CH_3)=C(CH_3)-CH_3$
A-348	$CH_2-CH(CH_2-CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
A-349	$CH_2-C(CH_3)(CH=CH_2)-CH_2-CH_3$
A-350	$C(=CH_2)-CH(CH_2-CH_3)-CH_2-CH_3$
A-351	$C(CH_3)=C(CH_2-CH_3)-CH_2-CH_3$
A-352	$CH(CH_3)-C(=CH-CH_3)-CH_2-CH_3$
A-353	$CH(CH_3)-CH(CH=CH_2)-CH_2-CH_3$
A-354	$CH=C(CH_2-CH_3)-CH(CH_3)-CH_3$
A-355	$CH_2-C(=CH-CH_3)-CH(CH_3)-CH_3$
A-356	$CH_2-CH(CH=CH_2)-CH(CH_3)-CH_3$
A-357	$CH_2-C(CH_2-CH_3)=C(CH_3)-CH_3$
A-358	$CH_2-CH(CH_2-CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
A-359	$C(=CH-CH_3)-CH_2-CH(CH_3)-CH_3$
A-360	$CH(CH=CH_2)-CH_2-CH(CH_3)-CH_3$
A-361	$C(CH_2-CH_3)=CH-CH(CH_3)-CH_3$
A-362	$CH(CH_2-CH_3)CH=C(CH_3)-CH_3$
A-363	$CH(CH_2-CH_3)CH_2-C(=CH_2)-CH_3$
A-364	$C(=CH-CH_3)CH(CH_3)-CH_2-CH_3$

A-365	$\text{CH}(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-366	$\text{C}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-367	$\text{CH}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_2)=\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-368	$\text{CH}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-369	$\text{CH}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-370	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-371	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-372	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-373	$\text{C}[\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3]-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-374	$\text{CH}[\text{C}(\text{CH}_2)=\text{CH}_2]-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-375	$\text{C}(\text{i-C}_3\text{H}_7)=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-376	$\text{CH}(\text{i-C}_3\text{H}_7)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-377	$\text{CH}(\text{i-C}_3\text{H}_7)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-378	$\text{C}(\text{CH}=\text{CH}_2)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-379	$\text{CH}(\text{CH}=\text{CH}_2)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-380	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$
A-381	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2-\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_2)=\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-382	2-CH ₃ -cyclohex-1-enyl
A-383	[2-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉
A-384	2-CH ₃ -cyclohex-2-enyl
A-385	2-CH ₃ -cyclohex-3-enyl
A-386	2-CH ₃ -cyclohex-4-enyl
A-387	2-CH ₃ -cyclohex-5-enyl
A-388	2-CH ₃ -cyclohex-6-enyl
A-389	3-CH ₃ -cyclohex-1-enyl
A-390	3-CH ₃ -cyclohex-2-enyl
A-391	[3-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉
A-392	3-CH ₃ -cyclohex-3-enyl
A-393	3-CH ₃ -cyclohex-4-enyl
A-394	3-CH ₃ -cyclohex-5-enyl
A-395	3-CH ₃ -cyclohex-6-enyl
A-396	4-CH ₃ -cyclohex-1-enyl
A-397	4-CH ₃ -cyclohex-2-enyl
A-398	4-CH ₃ -cyclohex-3-enyl
A-399	[4-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉

Die neuen Verbindungen der Formel I können in Analogie zu bekannten Verfahren des Standes der Technik hergestellt werden.

Beispielsweise können die Verbindungen der Formel I durch Umsetzung von entsprechend substituierten 5-Halogenpyrimidinen II mit entsprechend substituierten metallorganischen Verbindungen III hergestellt werden (siehe Schema 1).

5 Schema 1:



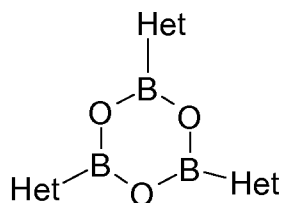
In Schema 1 weisen Het, R¹, R² und R³ die zuvor genannten Bedeutungen auf, wobei
 10 R³ typischerweise nicht für Br oder I steht. R³ steht insbesondere für Wasserstoff, Alkyl, Fluor oder Chlor; Hal steht für Halogen, vorzugsweise Brom oder Iod. Met steht für einen über ein Metallatom wie Sn, Zn oder Mg oder ein Halbmetallatom B gebundenen Rest, beispielsweise für B(OH)₂ oder B(OR^Φ)(OR^Ψ) mit R^Φ, R^Ψ = C₁-C₄-Alkyl, MgX mit X = Halogen, Zn-R^Ω mit R^Ω = Alkyl, oder für SnR^Δ₃ mit R^Δ = C₁-C₄-Alkyl.

15

Vorzugsweise erfolgt die Umsetzung in Gegenwart katalytisch aktiver Mengen eines Übergangsmetalls der 8. Nebengruppe des Periodensystems, z. B. Nickel, Palladium oder Platin, insbesondere in Gegenwart eines Palladiumkatalysators. Geeignete Katalysatoren sind beispielsweise Palladium-Phosphin-Komplexe wie
 20 Tetrakis(triphenylphosphin)palladium(0), PdCl₂(o-tolyl₃P)₂, Bis(triphenylphosphin)-palladium(II)-chlorid, der [1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocen]palladium(II)-chlorid-Dichlormethan-Komplex, Bis-[1,2-bis(diphenylphosphin)ethan]palladium(0) und [1,4-Bis(diphenylphosphin)butan]palladium(II)-chlorid, Palladium auf Aktivkohle in Gegenwart von Phosphinverbindungen sowie Palladium(II)-Verbindungen wie Palladium(II)chlorid oder Bis(acetonitril)palladium(II)-chlorid, in Gegenwart von Phosphinverbindungen wie Triphenylphosphin, 1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocen,
 25 1,2-Bis(diphenylphosphin)ethan, 1,3-Bis(diphenylphosphin)propan und 1,4-Bis(diphenylphosphin)butan. Die Menge an Katalysator beträgt üblicherweise 0,1 bis 20 mol-%, bezogen auf die Verbindung II.

30

Geeignete metallorganische Verbindungen III sind insbesondere entsprechend substituierte Hetarylboronsäure und Hetarylboronsäureester (Verbindungen III mit Met = B(OH)₂ oder B(OR^Φ)(OR^Ψ) mit R^Φ, R^Ψ = C₁-C₄-Alkyl). Ebenfalls geeignet sind Verbindungen Het-Met, die für ein entsprechendes Boronsäureanhydrid der Formel



stehen. Die Umsetzung erfolgt unter den Bedingungen einer Suzuki-Kupplung, wie sie
 5 z. B. aus Suzuki et al., Chem. Rev., 1995, 95, 2457-2483 und der darin zitierten Litera-
 tur bekannt sind. Die Hetarylboronsäuren und deren Ester lassen sich aus den ent-
 sprechenden Hetaryllithiumverbindungen oder Hetarylmagnesiumverbindungen durch
 Umsetzung mit Borsäureestern $B(OR^{\Phi})_3$ mit $R^{\Phi} = C_1-C_4$ -Alkyl herstellen. Hetaryllithi-
 umverbindungen können ihrerseits durch direkte Metallierung CH-acider Heteroaroma-
 10 ten mit Lithiumbasen wie Lithiumdiisopropylamid oder Butyllithium, oder durch Lithiie-
 rung von Halogenhetarylverbindungen mit Alkylolithium wie n-Butyllithium hergestellt
 werden.

Geeignete metallorganische Verbindungen III sind auch Hetarylstannane (Verbindun-
 15 gen III mit $Met = SnR^{\Delta}_3$ mit $R^{\Delta} = C_1-C_4$ -Alkyl). Die Umsetzung erfolgt dann unter den
 Bedingungen einer Stille-Kupplung, wie sie z.B. aus D. Milstein, J. K. Stille, J. Am.
 Chem. Soc. 1978, 100, S. 3636-3638 oder V. Farina, V. Krishnamurthy, W. J. Scott,
 Org. React. 1997, 50, 1-652 bekannt sind. Hetarylstannane III können in Analogie zu
 bekannten Verfahren durch Umsetzung von Hetaryllithiumverbindungen mit R^{Δ}_3SnCl
 20 hergestellt werden.

Geeignete metallorganische Verbindungen III sind weiterhin Grignardreagenzien (Ver-
 bindungen III mit $Met = Mg-Hal$ mit $Hal = Cl, Br$, insbesondere Br). Die Umsetzung er-
 folgt dann unter den Bedingungen einer Kumada-Kupplung, wie sie z. B. aus Kumada,
 25 Tetrahedron, 1982, 38, 3347 oder A. C. Frisch, N. Shaikh, A. Zapf, M. Beller, Angew.
 Chem., 2002, 114, 4218-4221 bekannt sind.

Geeignete metallorganische Verbindungen III sind weiterhin zinkorganische Verbin-
 dungen (Verbindungen III mit $Met = Zn-Hal$ mit $Hal = Cl, Br$, insbesondere Br). Die Um-
 30 setzung erfolgt dann unter den Bedingungen einer Negishi-Kupplung, wie sie z. B. aus
 A. Lützen, M. Hapke, Eur. J. Org. Chem., 2002, 2292-2297 bekannt sind. Hetarylzink-
 verbindungen können in an sich bekannter Weise aus den Hetaryllithiumverbindungen
 oder aus den Hetarylmagnesiumverbindungen durch Umsetzung mit Zinksalzen wie
 Zink-Chlorid hergestellt werden.

Die Umsetzung von II mit der Metallorganischen Verbindung III erfolgt insbesondere im Falle der Suzuki-Kupplung unter basischen Bedingungen. Geeignete Basen sind Alkalimetallcarbonate und Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Cäsiumcarbonat und Natriumhydrogencarbonat, Erdalkalimetallcarbonate und

5 Erdalkalimetallhydrogencarbonate wie Magnesiumcarbonat und Magnesiumhydrogencarbonat, oder tertiäre Amine wie Triethylamin, Trimethylamin, Triisopropylamin und N-Ethyl-N-diisopropylamin.

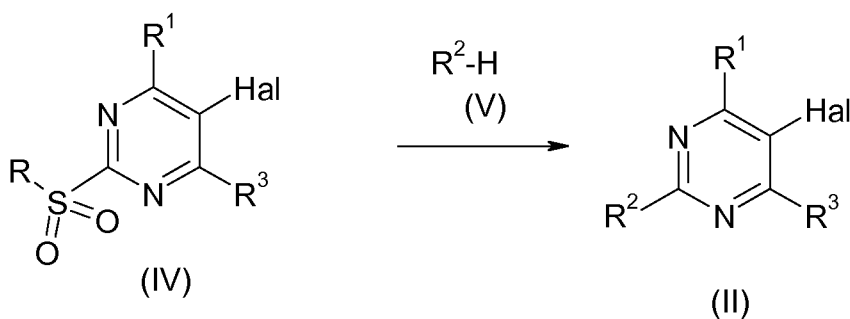
Üblicherweise erfolgt die Kupplung der Verbindung II mit der Verbindung III in einem

10 Lösungsmittel. Als Lösungsmittel sind organische Solventien wie Ether, z. B. 1,2-dimethoxyethan, cyclische Ether wie Tetrahydrofuran oder 1,4-Dioxan, Polyalkylenglykole wie Diethylenglykol, Carbonsäurenitrile wie Acetonitril, Propionitril, Carbonsäureamide wie Dimethylformamid oder Dimethylacetamid geeignet. Bei der Suzuki-Kupplung können die vorgenannten Lösungsmittel auch im Gemisch mit Wasser eingesetzt werden, z. B. kann das Verhältnis von organischem Lösungsmittel zu Wasser

15 im Bereich von 5 : 1 bis 1 : 5 liegen.

Die Verbindungen II, worin R^2 für Cyano oder für eine über ein Heteroatom gebundene Gruppe steht, wie Hydroxy, Mercapto, Azido, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkenylthio, Alkinylthio, Halogenalkylthio, $ON(=CR^{29}R^{30})$, $O-C(=Z)R^{25}$, $NR^{22}R^{23a}$, $NR^{31}(C(=Z)R^{25})$, $NR^{31}(C(=Z)OR^{21})$, $NR^{31}(C(=Z)-NR^{22}R^{23})$, $NR^{32a}(N=CR^{29}R^{30})$, $NR^{32}NR^{22}R^{23}$ oder $NR^{32}OR^{21}$, können vorteilhaft aus den entsprechend substituierten Sulfonen IV erhalten werden (siehe Schema 2).

25 Schema 2:



In Schema 2 haben R^1 , R^2 , R^3 und Hal die zuvor genannten Bedeutungen. R^3 steht insbesondere für Alkyl oder Halogen. R steht für C_1 - C_6 -Alkyl, und Hal steht für Halogen, vorzugsweise Brom oder Iod.

30

Die Sulfone der Formel IV werden mit Verbindungen V in der Regel unter basischen Bedingungen umgesetzt. Aus praktischen Gründen kann man direkt das Alkalimetall-, Erdalkalimetall- oder Ammoniumsalz der Verbindung V eingesetzt werden. Alternativ

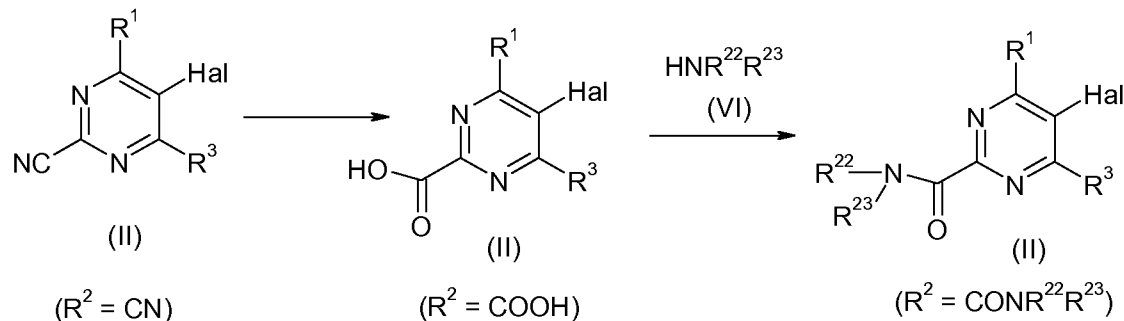
35 ist der Zusatz von Base möglich. Diese Umsetzung erfolgt typischerweise unter den

- Bedingungen einer nucleophilen Substitution; üblicherweise bei 0 bis 200 °C, vorzugsweise bei 10 bis 150 °C. Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzung in Gegenwart eines Phasentransferkatalysators, z. B. 18-Krone-6, durchzuführen. Üblicherweise erfolgt die Umsetzung in Gegenwart eines dipolar aprotischen Lösungsmittels wie N,N-dialkylierte Carbonsäureamide, z. B. N,N-Dimethylformamid, cyclische Ether, z. B. Tetrahydrofuran oder Carbonsäurenitrile wie Acetonitril [vgl. DE-A 39 01 084; Chimia, Bd. 50, S. 525-530 (1996); Khim. Geterotsikl. Soedin, Bd. 12, S. 1696-1697 (1998)].
- 5
- 10 Im Allgemeinen werden die Verbindungen IV und V in etwa stöchiometrischen Mengen eingesetzt. Es kann jedoch von Vorteil sein, das Nucleophil der Formel R²-H im Überschuss einzusetzen, beispielsweise in einem bis zu 10-fachen, insbesondere bis zu 3-fachen Überschuss, bezogen auf die Verbindung II.
- 15 In der Regel wird die Umsetzung in Gegenwart einer Base durchgeführt, die äquimolar oder auch im Überschuss eingesetzt werden kann. Als Basen kommen Alkalimetallcarbonate und -hydrogencarbonate, beispielsweise Natriumcarbonat und Natriumhydrogencarbonat, Stickstoffbasen wie Triethylamin, Tributylamin und Pyridin, Alkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat oder Kalium-tert.-butanolat, Alkalimetallamide wie
- 20 Natriumamid, oder Alkalimetallhydride wie Lithiumhydrid oder Natriumhydrid in Frage.
- Geeignete Lösungsmittel sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether wie Diethylether, Disopropylether, tert.-Butylether, 1,2-Dimethoxyethan, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, sowie Dimethylsulfoxid, N,N-dialkylierte Carbonsäureamide, wie Dimethylformamid oder Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt werden Ethanol, Dichlormethan, Acetonitril und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.
- 25
- 30 Verbindungen II, in denen R² für Cyano steht, sind wertvolle Zwischenverbindungen zur Herstellung weiterer Verbindungen I.
- Verbindungen II, in denen R² für einen derivatisierten Carbonsäurerest steht, wie C(=O)OR²¹, C(=O)NR²²R²³, C(=NOR³⁴)NR²²R²³, C(=O)NR²⁴-NR²²R²³, C(=N-NR³⁵R³⁶)NR²²R²³, C(=NOR³⁴)NR²⁴-NR²²R²³, C(=O)R²⁵, CR²⁶R²⁷-OR²⁸, CR²⁶R²⁷-NR²²R²³ können vorteilhaft aus Verbindungen II, in denen R² für Cyano steht, nach Standardverfahren zur Derivatisierung von CN-Gruppen erhalten werden.
- 35
- Verbindungen II, in denen R² für C(=O)NR²²R²³ steht, sind aus Verbindungen II, in denen R² für Cyano steht, durch Verseifung zu den Carbonsäuren (R² steht für COOH)

unter sauren oder basischen Bedingungen und Amidierung mit Aminen VI, $\text{HNR}^{22}\text{R}^{23}$, erhältlich, siehe Schema 2a.

Schema 2a:

5



In Schema 2a haben R^1 , R^3 , R^{22} , R^{23} die zuvor genannten Bedeutungen. R^3 steht insbesondere für Alkyl oder Halogen, Hal steht für Halogen, vorzugsweise Brom oder Iod.

10 Die Verseifung des Nitrils II (R^2 steht für CN) erfolgt üblicherweise in inerten polaren Lösungsmitteln wie Wasser oder Alkoholen, bevorzugt mit anorganischen Basen wie Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxiden, insbesondere NaOH. In einer bevorzugten Ausgestaltung erfolgt die Verseifung des Nitrils II durch Umsetzung mit Wasserstoffperoxid unter alkalischen Bedingungen.

15

Die Umsetzung der Säure II (R^2 steht für COOH) mit dem Amin VI erfolgt vorteilhaft unter den aus Chem. and Pharm. Bull. 1982, Bd. 30, N12, S. 4314, bekannten Bedingungen. Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Säure II vor der Umsetzung mit dem Amin VI zu aktivieren, z. B. in ihr Säurechlorid zu überführen. Im Falle von Carbonsäuren II, die zur Decarboxylierung neigen, kann es von Vorteil sein, die freie Säure nicht zu isolieren sondern ihr Alkalimetallsalz direkt mit üblichen Halogenierungsmitteln, beispielsweise mit Oxalylchlorid in das Säurechlorid zu überführen und letzteres mit dem Amin, ggf. in Anwesenheit einer Hilfsbase umzusetzen.

25

Die Herstellung der Amide II gelingt alternativ nach Standardmethoden aus den entsprechenden Iminoestern (R^2 steht für $\text{C}(\text{=NH})\text{OR}^{21}$), die ihrerseits durch saure Verseifung der Nitrile II in alkoholischen Lösungsmitteln hergestellt werden können.

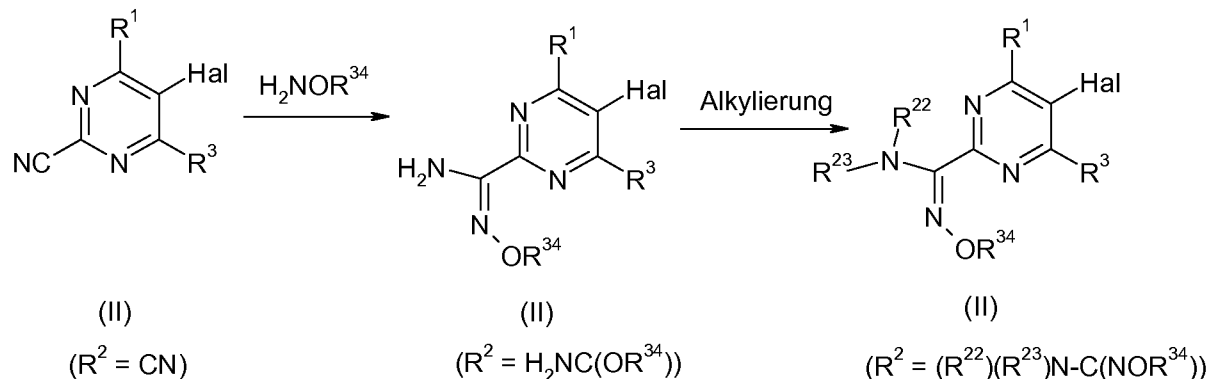
30

Aus Amidien der Formel II (mit R^2 steht für $\text{CONR}^{22}\text{R}^{23}$) werden durch Oximierung mit Hydroxylamin oder substituierten Hydroxylaminen $\text{H}_2\text{N-OR}^{34}$ unter basischen Bedingungen die Verbindungen der Formel II, in denen R^2 für $\text{C}(\text{=NOR}^{34})\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ steht, erhalten [vgl. US 4,876,252]. Die substituierten Hydroxylamine können als freie Base oder bevorzugt in Form ihrer Säureadditionssalze eingesetzt werden. Aus praktischen

Gründen kommen insbesondere die Halogenide wie Chloride oder die Sulfate in Betracht.

Alternativ können die Amidoxime der Formel II, in denen R^2 für $C(=NOR^{34})NR^{22}R^{23}$ steht, auch aus den entsprechenden Nitrilen II durch Umsetzung mit Hydroxylamin beziehungsweise substituierten Hydroxylaminen H_2N-OR^{34} unter basischen Bedingungen hergestellt werden, siehe Schema 2b. Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus DE-A 198 37 794 bekannten Bedingungen. Die erhaltenen Verbindungen II, in denen R^2 für $C(=NOR^{34})NH_2$ steht, können mono- oder dialkyliert werden, wobei man die Verbindungen $C(=NOR^{34})NR^{22}R^{23}$ erhält, in denen R^{22} und/oder R^{23} von Wasserstoff verschieden ist. Geeignete Alkylierungsmittel sind beispielsweise C_1 - C_6 -Alkylhalogenide, Di- C_1 - C_6 -alkylsulfate oder Phenolsulfonsäure- C_1 - C_6 -alkylester, wobei der Phenylrest gegebenenfalls ein oder zwei unter Nitro und C_1 - C_6 -Alkyl ausgewählte Reste trägt. Üblicherweise führt man die Alkylierung in Gegenwart einer Base durch. Als Base kommen grundsätzlich alle Verbindungen in Betracht, die in der Lage sind, den Amidstickstoff zu deprotonieren. Geeignete Basen sind beispielsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetallhydroxide wie Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid oder Lithiumhydroxid.

20 Schema 2b:



In Schema 2b weisen R^1 , R^3 , R^{22} , R^{23} , R^{34} die zuvor genannten Bedeutungen auf, R^3 steht insbesondere für Alkyl oder Halogen, und Hal steht für Halogen, vorzugsweise Brom oder Iod.

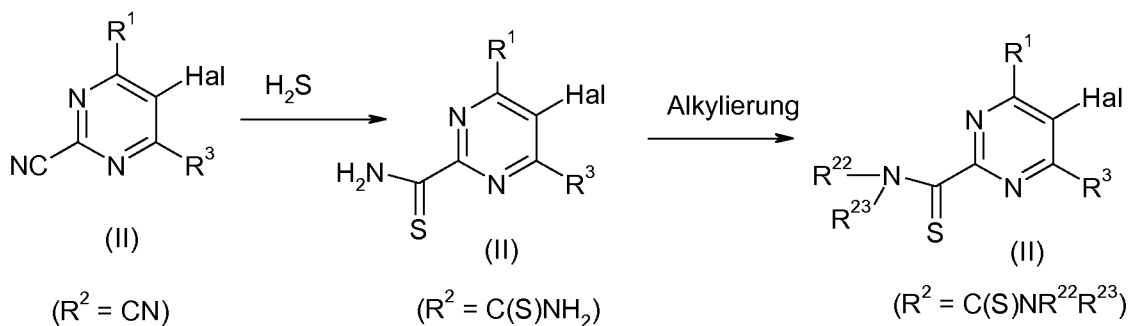
Verbindungen der Formel II, in denen R^2 für $C(=N-NR^{35}R^{36})NR^{22}R^{23}$ steht, können vorteilhaft aus den entsprechenden Cyanoverbindungen II durch Umsetzung mit $H_2N-NR^{35}R^{36}$ zu den entsprechenden Verbindungen II, worin R^2 für $C(=N-NR^{35}R^{36})NH_2$ steht, hergestellt werden. Die auf diese Weise erhaltenen Verbindungen können mono- oder dialkyliert werden, wobei man Verbindungen II erhält, worin R^2 für

$C(=N-NR^{35}R^{36})NR^{22}R^{23}$ steht und in denen R^{22} und/oder R^{23} von Wasserstoff verschieden ist. Bezüglich geeigneter Verfahren zur Alkylierung wird auf das zuvor Gesagte Bezug genommen.

- 5 Verbindungen der Formel II, in denen R^2 für $C(=O)R^{25}$ steht, sind aus den entsprechenden Cyanoverbindungen II durch Umsetzung mit Grignard-Reagentien $R^{25}-Mg-Hal'$, in denen Hal' für ein Halogenatom, insbesondere für Chlor oder Brom steht, zugänglich. Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Heterocycl. Chem. 1994, Bd. 31(4), S. 1041 bekannten Bedingungen.
- 10 Verbindungen der Formel II, in denen R^2 für $CR^{26}R^{27}-OR^{28}$ steht, sind aus den entsprechenden Ketonen, in denen R^2 für $C(=O)R^{25}$ steht, durch Umsetzung mit Grignard-Reagenzien $R^{26}R^{27}-Mg-Hal^*$, in denen Hal^* für ein Halogenatom, insbesondere für Chlor oder Brom steht, und gegebenenfalls anschließende Alkylierung zugänglich.
- 15 Verbindungen der Formel II, in denen R^2 für CH_2-OR^{28} steht, sind aus den entsprechenden Ketonen, in denen R^2 für $C(=O)R^{25}$ steht, durch Reduktion mit einem Metallhydrid, beispielsweise Lithiumaluminiumhydrid, und gegebenenfalls anschließende Alkylierung zugänglich.
- 20 Verbindungen der Formel II, in denen R^2 für $C(=N-NR^{35}R^{36})R^{25}$ steht, sind über Verbindungen II (worin R^2 für $C(=O)R^{25}$ steht) zugänglich, welche mit Hydrazinen $H_2NNR^{35}R^{36}$ umgesetzt werden, bevorzugt unter den aus J. Org. Chem. 1966, Bd. 31, S. 677 bekannten Bedingungen.
- 25 Verbindungen II, in denen R^2 für $C(=NOR^{34})R^{25}$ steht, sind über Oximierung von Verbindungen II (R^2 steht für $C(=O)R^{25}$) zugänglich. Die Oximierung erfolgt wie voranstehend beschrieben.
- 30 Verbindungen II, in denen R^2 für $C(=O)OR^{21}$ steht, sind durch Veresterung der Verbindungen II (R^2 steht für $COOH$) unter sauren oder basischen Bedingungen erhältlich.
- 35 Verbindungen II, in denen R^2 für $C(=S)NR^{22}R^{23}$ steht, sind durch Umsetzung von Verbindungen II, in denen R^2 für CN steht, erhältlich, siehe Schema 2c.

Schema 2c:

73

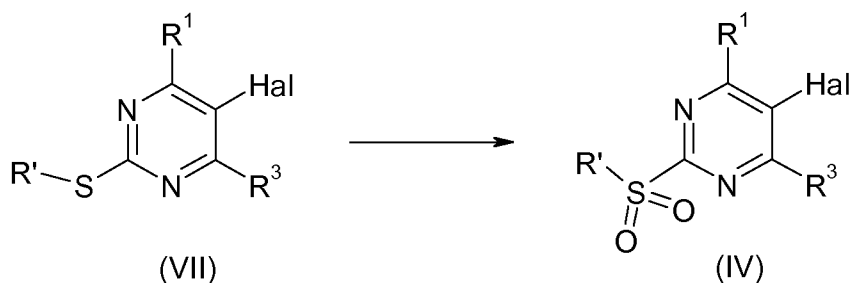


- In Schema 2c haben R^1 , R^3 , R^{22} , R^{23} die zuvor genannten Bedeutungen. R^3 steht insbesondere für Alkyl oder Halogen, Hal steht für Halogen, vorzugsweise Brom oder Iod.
- 5 In der Regel setzt man die Cyanoverbindung II in Gegenwart eines Lösungsmittels oder Verdünnungsmittels mit Schwefelwasserstoffgas um. Geeignete Lösungsmittel oder Verdünnungsmittel sind beispielsweise aromatische Amine wie Pyridin, substituierte Pyridine, wie Collidin und Lutidin, oder tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Triisopropylamin und N-Methylpiperidin. Die so erhaltenen Aminothiocarbonylverbindungen II (R^2 steht für $\text{C}(=\text{S})\text{NH}_2$) können dann gegebenenfalls am Amidstickstoff ein- oder zweifach alkyliert werden. Bezüglich geeigneter Verfahren zur Alkylierung wird auf das zuvor Gesagte Bezug genommen.
- 10

- Alternativ sind Verbindungen II, in denen R^2 für $\text{C}(=\text{S})\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ steht, durch Schwefelung aus den entsprechenden Carbonsäureamidverbindungen II (Verbindungen II, worin R^2 für $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ steht) erhältlich. Beispiele für geeignete Schwefelungsmittel sind Organophosphorsulfide wie das Lawessons Reagenz, (2,2-Bis-(4-methoxyphenyl)-1,3,2,4-dithiodiphosphetan-2,4-disulfid, Organozinnnsulfide wie Bis(tricyclohexylzinn)sulfid, oder Phosphorpentasulfid (siehe auch J. March, Advanced Organic Chemistry, 4. Aufl., Wiley Interscience 1992, S.893f und die darin zitierte Literatur).
- 15
- 20

- Verbindungen IV können beispielsweise nach der in Schema 3 dargestellten Synthese durch Oxidation der Thioether VII hergestellt werden.
- 25

Schema 3:



In Schema 3 weisen R¹ und R³ die zuvor genannten Bedeutungen auf. R³ steht insbesondere für Alkyl oder Halogen. Hal steht für Halogen, vorzugsweise Brom oder Iod und R' steht für C₁-C₆-Alkyl.

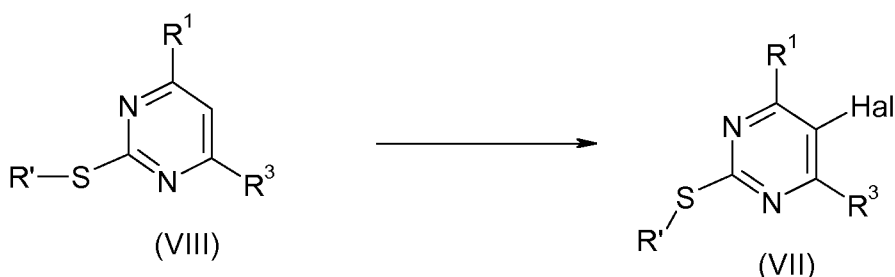
5

Geeignete Oxidationsmittel sind beispielsweise Wasserstoffperoxid, Selendioxid [vgl. WO 02/88127] oder organische Carbonsäuren wie 3-Chlorperbenzoesäure. Die Oxidation wird vorzugsweise bei 10 bis 50 °C in Gegenwart protischer oder aprotischer Lösungsmittel durchgeführt [vgl. B. Kor. Chem. Soc., Bd. 16, S. 489-492 (1995); Z.

10 Chem., Bd. 17, s. 63 (1977)].

Verbindungen VII, in denen Hal für Halogen, insbesondere Brom oder Iod steht, sind beispielsweise gemäß dem in Schema 4 skizzierten Syntheseweg erhältlich.

15 Schema 4:



In Schema 4 haben R¹ und R³ die zuvor genannten Bedeutungen. R³ steht insbesondere für Alkyl oder Halogen, R' steht für C₁-C₆-Alkyl. Hal steht für Halogen, vorzugsweise Brom oder Iod.

20

Die Etherverbindung VIII können nach üblichen Methoden in die 5-Halogenpyrimidine VII überführt werden. Geeignete Halogenierungsmittel sind vorzugsweise Chlorierungsmittel, Bromierungsmittel und Iodierungsmittel. Ein geeignetes Chlorierungsmittel ist beispielsweise N-Chlorsuccinimid. Geeignete Bromierungsmittel sind Brom und N-Bromsuccinimid. Üblicherweise erfolgt die Bromierung in Gegenwart eines Lösungsmittels. Geeignete Lösungsmittel für die Bromierung sind beispielsweise Carbonsäuren wie Essigsäure. Geeignete Iodierungsmittel sind Iodwasserstoff, Chloriodid oder N-Iodsuccinimid. Die Iodierung erfolgt üblicherweise in einem Lösungsmittel. Geeignete Lösungsmittel sind chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan bei Verwendung von Iodwasserstoff, C₁-C₄-Alkohole wie Methanol oder Carbonsäuren wie Essigsäure bei Verwendung von Chloriodid und halogenierte Carbonsäuren wie Tri-

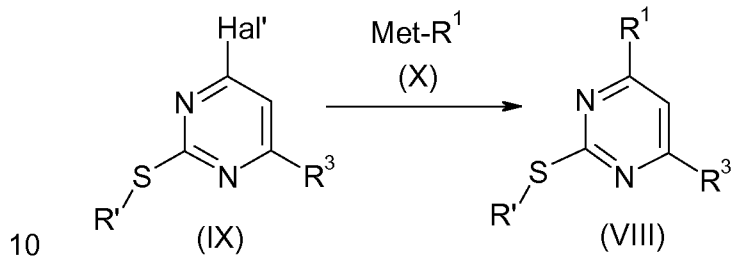
25

30

fluoressigsäure bei Verwendung von N-Iodsuccinimid. Die Halogenierung erfolgt üblicherweise zwischen 10 °C und der Siedetemperatur des Lösungsmittels.

- Thioetherverbindungen VIII können ausgehend von 4-Halogenpyrimidinverbindungen IX durch Umsetzung mit entsprechend substituierten metallorganischen Verbindungen X hergestellt werden (siehe Schema 5).

Schema 5:

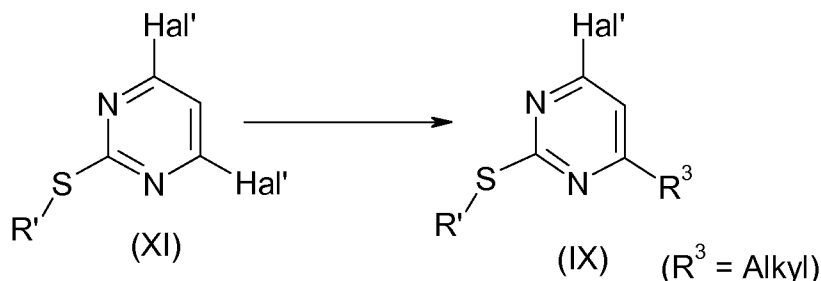


- In Schema 5 haben R¹ und R³ die zuvor genannten Bedeutungen. R³ steht insbesondere für Halogen oder Alkyl, R' steht für C₁-C₆-Alkyl, und Hal' steht für Halogen, insbesondere Chlor. Für die Umsetzung gemäß Schema 5 gilt im Übrigen das zu Schema 1
- 15 Gesagte entsprechend. Insbesondere können die dort genannten Reaktionsbedingungen und Katalysatoren verwendet werden. Ebenso können die dort genannten bevorzugten metallorganischen Verbindungen eingesetzt werden, wobei der dort genannte Rest Het in diesen Verbindungen jeweils durch den Rest R¹ ersetzt ist.

- 20 4-Halogenpyrimidine IX, in denen R³ für Alkyl steht, werden vorteilhaft erhalten, indem man 4,6-Dihalogenpyrimidine XI mit einem Grignardreagenz R³-MgCl unter den Bedingungen einer Kumada-Kupplung umsetzt, wie in Schema 6 beschrieben.

Schema 6:

25

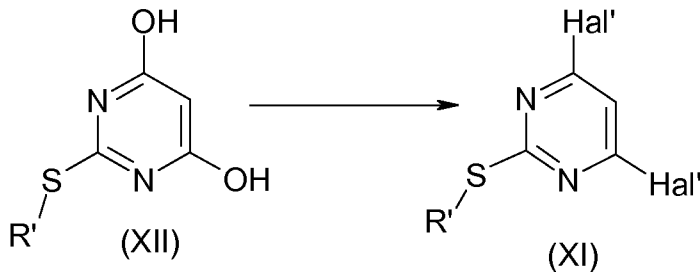


In Schema 6 stehen Hal' unabhängig voneinander für Halogen, vorzugsweise für Chlor, und R' steht für C₁-C₆-Alkyl.

30

4,6-Dihalogenpyrimidine XI werden beispielsweise vorteilhaft erhalten, indem man 4,6-Dihydroxypyrimidine XII mit Halogenierungsmitteln, insbesondere Chlorierungsmitteln oder Bromierungsmitteln, umsetzt; wie in Schema 7 beschrieben.

5 Schema 7:



In Schema 7 steht Hal' unabhängig voneinander für Halogen, vorzugsweise Chlor, und R' steht für C₁-C₆-Alkyl. Als Chlorierungsmittel für die Umwandlung der Dihydroxyverbindung XII in die Verbindungen XI eignen sich insbesondere POCl₃, PCl₃/Cl₂ oder PCl₅, oder Mischungen dieser Reagenzien. Die Umsetzung kann in überschüssigem Chlorierungsmitteln (POCl₃) oder einem inerten Lösungsmittel, beispielsweise Carbon säurenitril, z. B. Acetonitril oder Propionitril, aromatische Kohlenwasserstoffe, z. B. Toluol, chlorierte Kohlenwasserstoffe, z. B. 1,2-Dichlorethan, oder chlorierte aromatische Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol durchgeführt werden.

Die Umsetzung erfolgt in der Regel zwischen 10 und 180 °C. Das Verfahren wird vorteilhaft unter Zusatz von N,N-Dimethylformamid in katalytischen oder subkatalytischen Mengen oder von Stickstoffbasen, wie beispielsweise N,N-Dimethylanilin durchgeführt.

4,6-Dihydroxypyrimidine XII können beispielsweise nach der in Schema 8 skizzierten Route erhalten werden. Zunächst wird der Malonsäureester XIII mit Thioharnstoff in die 2-Mercaptopyrimidinverbindung XIIIa überführt. Die anschließende Alkylierung mit einem Alkylierungsmittel ergibt die Verbindung XII. Als Alkylierungsmittel kommen z. B. C₁-C₆-Alkylhalogenide, vorzugsweise Alkylbromide und Alkylchloride, Di-C₁-C₆-alkylsulfate oder Phenolsulfonsäure-C₁-C₆-alkylester in Betracht. Die Umsetzung der Malonester der Formel XIII mit Thioharnstoff kann in Gegenwart oder Abwesenheit von Lösungsmitteln durchgeführt werden. Vorteilhaft ist es, solche Lösungsmittel zu verwenden, gegenüber denen die Einsatzstoffe weitgehend inert sind und in denen sie ganz oder teilweise löslich sind.

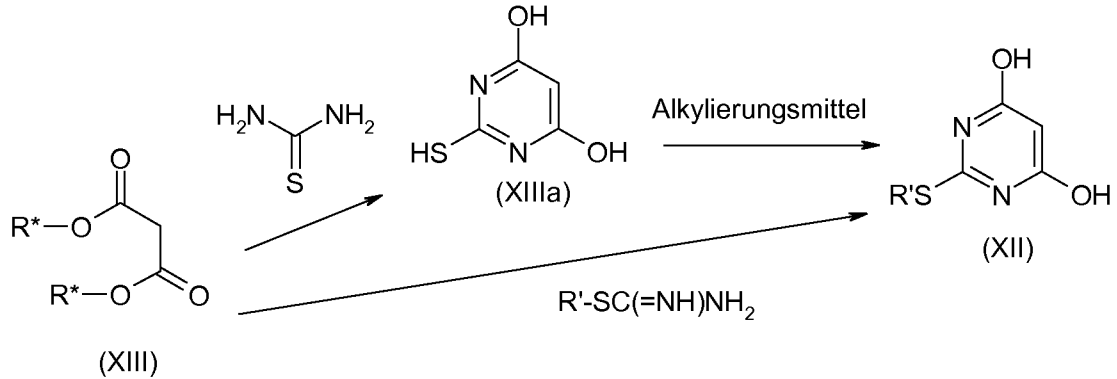
Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Alkylierung in Gegenwart einer Base durchzuführen.

35

Alternativ kann man den Malonsäureester XIII auch mit einem S-Alkylisothioharnstoff umsetzen, so dass man direkt den Thioether XII erhält; siehe Schema 8.

Schema 8:

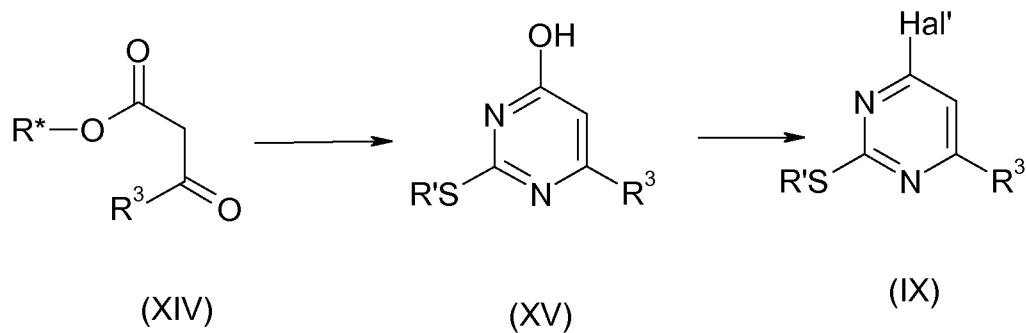
5



In Schema 8 steht R* für Alkyl, vorzugsweise C₁-C₆-Alkyl und R' steht für C₁-C₆-Alkyl.

- 10 Verbindungen IX, in denen R³ für Alkyl steht, sind alternativ auf dem in Schema 9 dargestellten Weg erhältlich.

Schema 9:



15

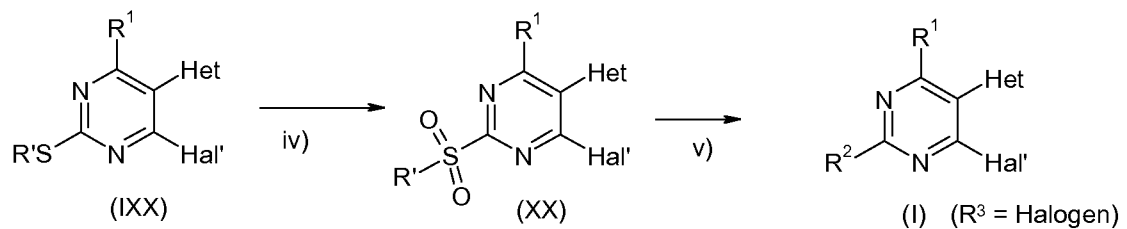
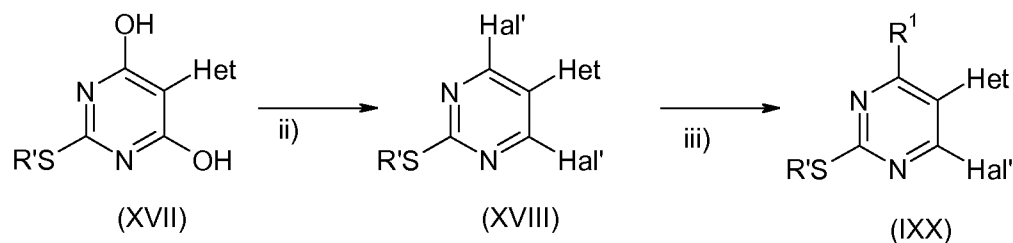
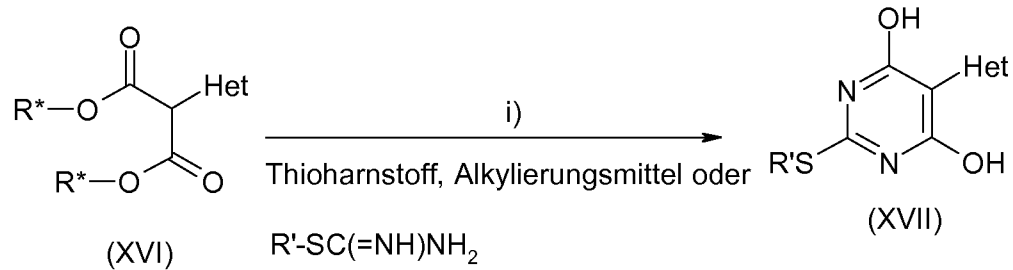
In Schema 9 steht R* für Alkyl, vorzugsweise C₁-C₆-Alkyl, R' steht für C₁-C₆-Alkyl und Hal' für Halogen, vorzugsweise Chlor.

- 20 Zunächst wird ein β-Ketoester der Formel XIV entweder durch Umsetzung mit einem S-Alkylisothioharnstoff oder durch Umsetzung mit Thioharnstoff und anschließende Alkylierung in eine 2-Thioetherverbindung XV umgewandelt, wie in Schema 8 beschrieben. Danach setzt man den Thioether XV mit einem Halogenierungsmittel unter den in Schema 7 beschriebenen Bedingungen zu einem 4-Halogenpyrimidin der Formel IX um.
- 25

Alternativ können Verbindungen der Formel I auch wie in den Schemata 10 und 11 beschrieben erhalten werden.

Schema 10:

5



10

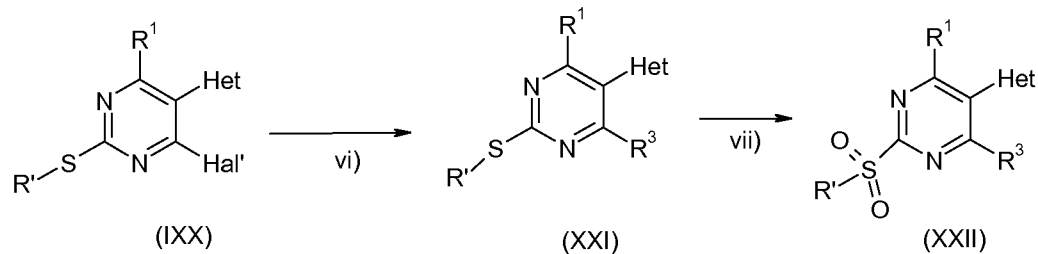
In Schema 10 haben R^1 , Het die zuvor genannten Bedeutungen, R^* steht für Alkyl, vorzugsweise C_1-C_6 -Alkyl, R' steht für C_1-C_6 -Alkyl und Hal' steht für Halogen.

- 15 In Schritt i) setzt man Hetarylmalonate der allgemeinen Formel XVI mit Thioharnstoff und anschließend mit einem Alkylierungsmittel unter Erhalt des Thioethers XVII um, oder man setzt das Hetarylmalonat XVI direkt mit dem S-Alkylisothioharnstoff unter Erhalt der Verbindung XVIII um. Die Umsetzung erfolgt wie in Schema 8 beschrieben.
- 20 Die so erhaltenen Verbindungen XVII können danach in Schritt ii) nach den in Schema 7 beschriebenen Verfahren in die Dihalogenverbindungen XVIII umgewandelt werden. Die Dihalogenverbindungen XVIII können danach in Schritt iii) in die Thioetherverbindung IXX nach den in Schema 5 beschriebenen Verfahren umgewandelt werden. Die Thiolatgruppe in 2-Position der Verbindung IXX wird zur Alkylsulfonylgruppe in Schritt iv) gemäß dem in Schema 3 beschriebenen Verfahren oxidiert und so in eine gute Abgangsgruppe für weitere Austausch-Reaktionen überführt. Die Einführung des Restes
- 25 R^2 (Schritt v) kann beispielsweise wie in Schritt 2 beschrieben erfolgen. Gegebenen-

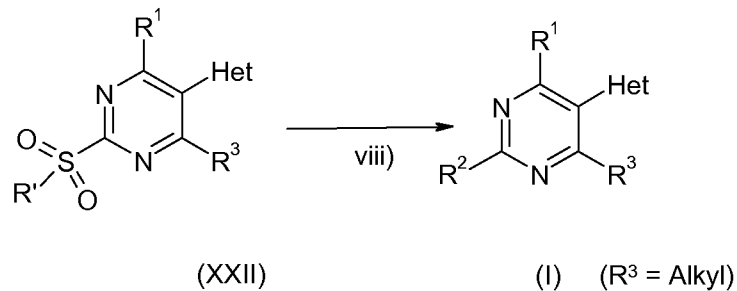
falls schließen sich an Schritt v) noch weitere Umwandlungen an, wie zuvor beschrieben, beispielsweise in den Schemata 2a, 2b oder 2c.

5 Eine weitere Route zur Herstellung der Verbindung I, in denen R³ für Alkyl steht ist in Schema 11 skizziert.

Schema 11:



10



In Schema 11 haben R¹, Het die zuvor genannte Bedeutung, R* für Alkyl, vorzugsweise C₁-C₆-Alkyl, R' steht für C₁-C₆-Alkyl und Hal' steht für Halogen.

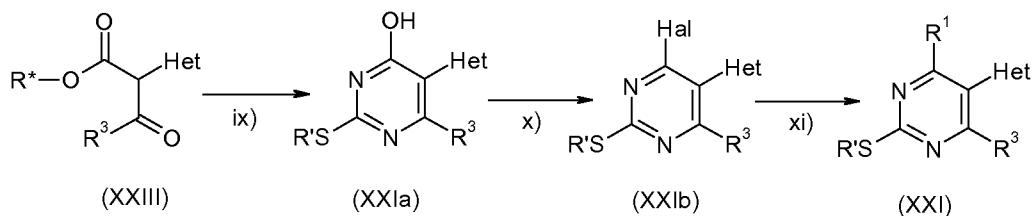
15

Die Halogenpyrimidinverbindung der Formel IXX wird in Schritt vi) in die entsprechende Alkylpyrimidinverbindung XXI wie in Schema 6 beschrieben überführt. Die Thiolatgruppe in 2-Position der Verbindung XXI wird zur Alkylsulfonylgruppe in Schritt vii) gemäß dem in Schema 3 beschriebenen Verfahren oxidiert und so in eine gute Abgangsgruppe für weitere Austausch-Reaktionen überführt. Die Einführung des Restes R² (Schritt viii) kann beispielsweise wie in Schritt 2 beschrieben erfolgen. Gegebenenfalls schließen sich an Schritt v) noch weitere Umwandlungen an, wie zuvor beschrieben, beispielsweise in den Schemata 2a, 2b oder 2c.

20

25 Eine weitere Route zur Herstellung von Verbindung XXI ist in Schema 12 skizziert.

Schema 12:



In Schema 12 haben R^3 , Het die zuvor genannte Bedeutung, R^* steht für Alkyl, vorzugsweise C_1 - C_6 -Alkyl, R^1 steht für C_1 - C_6 -Alkyl, und R^3 steht für Alkyl.

5

In Schritt ix) setzt man den substituierten β -Ketoester XXIII mit Thioharnstoff und anschließend mit einem Alkylierungsmittel unter Erhalt des Thioethers XXIIa um, oder man setzt den Hetaryl substituierten β -Ketoester direkt mit dem S-Alkylisothioharnstoff unter Erhalt der Verbindung XXIIa um. Die Umsetzungen erfolgen wie in Schema 9 beschrieben. Die Umsetzung gemäß Schritt x) unter Erhalt der Verbindung XXIIb und deren Umsetzung gemäß Schritt xi) unter Erhalt der Verbindung XXII erfolgt in analoger Weise wie in Schema 10 für die Schritte ii) bzw. iii) beschrieben.

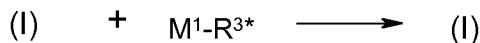
10

Verbindungen der Formel I, in denen R^3 für Cyano, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_8 -Alkylthio oder C_1 - C_8 -Halogenalkoxy steht, können vorteilhaft durch Umsetzung von Verbindungen I, in denen R^3 Halogen, bevorzugt Chlor bedeutet, mit Verbindungen $\text{M}^1\text{-R}^{3*}$ (im folgenden auch Verbindungen der Formel XXIV) erhalten werden. Bei den Verbindungen der Formel XXIV handelt es sich abhängig von der einzuführenden Gruppe R^{3*} um ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat, ein Thiolat oder ein Halogenalkoxylat. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in einem inerten Lösungsmittel. Das Kation M^1 in Formel XXIV hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammoniumsalze wie Tetramethylammonium- oder Tetraethylammoniumsalze oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt (Schema 13).

15

20

25 Schema 13:



($\text{R}^3 = \text{Halogen}$) (XXIV) { $\text{R}^3=\text{R}^{3*} = \text{CN}, \text{C}_1\text{-C}_8\text{-Alkoxy}, \text{C}_1\text{-C}_8\text{-Halogenalkoxy}$ }

Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120 °C, bevorzugt bei 10 bis 40 °C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

30

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether wie Dioxan, Diethylether, Methyl-tert-butylether und bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Di-

chlormethan oder Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, und Gemische davon.

5 Verbindungen der Formel I, in denen R³ für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₂-C₈-Alkinyl oder C₂-C₈-Halogenalkinyl steht, können in vorteilhafter Weise durch Umsetzung von Verbindungen I, in denen R³ für Halogen, insbesondere für Chlor steht, mit metallorganischen Verbindungen X^a-Mt, worin X^a für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₂-C₈-Alkinyl oder C₂-C₈-Halogenalkinyl und Mt für Lithium, Magnesium-Hal' oder Zink-Hal' (mit Hal' = Halogen) steht, hergestellt werden. Die Umsetzung erfolgt vorzugsweise in Gegenwart katalytischer oder insbesondere wenigstens äquimolarer Mengen an Übergangsmetallsalzen und/oder -verbindungen, insbesondere in Gegenwart von Cu-Salzen wie Cu(I)halogenide und speziell Cu(I)-iodid. In der Regel erfolgt die Umsetzung in einem inerten organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem der vorgenannten Ether, insbesondere Tetrahydrofuran, einem aliphatischen oder cycloaliphatischen Kohlenwasserstoff wie Hexan, Cyclohexan und dergleichen, einem aromatischen Kohlenwasserstoff wie Toluol oder in einer Mischung dieser Lösungsmittel. Die hierfür erforderlichen Temperaturen liegen im Bereich von -100 bis +100 °C und speziell im Bereich von -80 bis +40 °C. Verfahren hierzu sind bekannt, z. B. aus WO 03/004465.

20

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

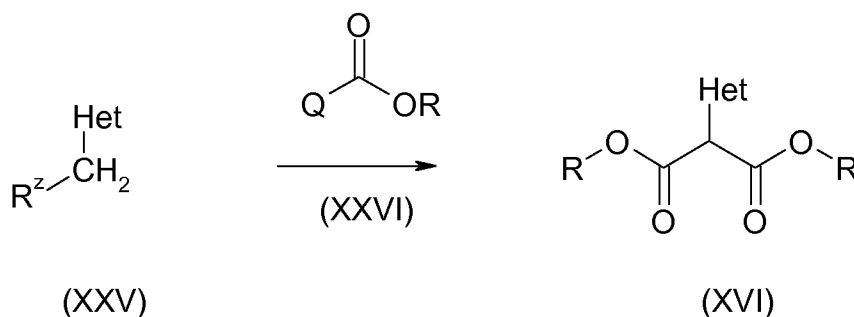
25

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

35

Hetarylmalonate der Formel XVI können ausgehend von Hetarylverbindungen der Formel XXV durch Umsetzung mit einem bzw. zwei Äquivalenten eines Kohlensäureesters oder eines Chloroformiats (Verbindung XXVI) in Gegenwart einer starken Base hergestellt werden (siehe Schema 14).

Schema 14:



In Schema 14 steht R^z für Wasserstoff oder eine C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl-Gruppe. Q steht für Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy, insbesondere für Methoxy oder Ethoxy. Het hat die zuvor genannten Bedeutungen und R steht für C_1 - C_4 -Alkyl. Der Fachmann wird erkennen, dass im Falle von $R^z = H$ wenigstens 2 Äquivalente der Verbindung XXVI eingesetzt werden müssen, um einen vollständigen Umsatz von XXV zu erzielen.

Die in Schema 14 gezeigte Umsetzung erfolgt üblicherweise in Gegenwart von starken Basen. Sofern R^z für Wasserstoff steht, wird man üblicherweise Alkalmetallamide wie Natriumamid oder Lithiumdiisopropylamid, oder Lithium-organische Verbindungen wie Phenyllithium oder Butyllithium als Base einsetzen. In diesem Falle wird man die Base wenigstens äquimolar, bezogen auf die Verbindung XXV einsetzen, um einen vollständigen Umsatz zu erreichen. Sofern R^z für eine Alkoxycarbonylgruppe steht, wird man vorzugsweise ein Alkalimetallalkoholat, z. B. Natrium- oder Kaliummethanolat, Natrium- oder Kaliumbutanolat, Natrium- oder Kaliummethanolat als Base einsetzen. Für $R^z = H$ kann die Umsetzung von XXV mit XXVI in einer Stufe oder in zwei separaten Stufen durchgeführt werden, wobei man in letztem Fall als Zwischenprodukt die Verbindung XXV erhält, worin R^z für eine Alkoxycarbonylgruppe steht. Im Übrigen kann die Umsetzung von XXV mit XXVI in Analogie zu der in J. Med. Chem. 25, 1982, S. 745 beschriebenen Methode durchgeführt werden.

Die Herstellung von Malonaten der Formel XVI gelingt außerdem vorteilhaft durch Reaktion entsprechender Brom-Hetarylverbindungen Br-Het mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse [vgl. Chemistry Letters, S. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

Die Herstellung von substituierten β -Ketoestern der Formel XXIII gelingt beispielsweise vorteilhaft durch Reaktion entsprechender Brom-Hetarylverbindungen Br-Het mit unsubstituierten β -Ketoestern unter Cu(I)-Katalyse.

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z. B. unter Licht-, Säure-

oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz, erfolgen.

- 5 Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Oomyceten und Basidiomyceten, insbesondere aus der Klasse der Oomyceten. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt-, Beiz- und Bodenfungizide eingesetzt werden.
- 10 Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbissen, sowie an den
- 15 Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria* Arten an Gemüse, Raps, Zuckerrüben und Obst und Reis , wie z. B. *A.solani* oder *A. alternata* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Aphanomyces* Arten an Zuckerrüben und Gemüse,
- *Ascochyta*-Arten an Getreide and Gemüse,
- *Bipolaris*- und *Drechslera* Arten an Mais, Getreide, Reis und Rasen, wie z. B. *D.maydis* an Mais,
- *Blumeria graminis* (Echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Blumen und Weinreben,
- *Bremia lactucae* an Salat,
- *Cercospora* Arten an Mais, Sojabohnen, Reis und Zuckerrüben,
- *Cochliobolus* Arten an Mais , Getreide, Reis, wie z. B. *Cochliobolus sativus* an Getreide, *Cochliobolus miyabeanus* an Reis,
- *Colletotricum* Arten an Sojabohnen und Baumwolle,
- *Drechslera* Arten, *Pyrenophora* Arten an Mais, Getreide, Reis und Rasen, wie z. B. *D.teres* an Gerste oder *D. tritici-repentis* an Weizen,
- *Esca* an Weinrebe, verursacht durch *Phaeoacremonium chlamydosporium*, *Ph. Aleophilum*, und *Formitipora punctata* (syn. *Phellinus punctatus*),
- *Exserohilum* Arten an Mais,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Gurkengewächsen,

- *Fusarium* und *Verticillium* Arten an verschiedenen Pflanzen wie z. B. *F. graminearum* oder *F. culmorum* an Getreide oder *F. oxysporum* an einer Vielzahl von Pflanzen wie z. B. Tomaten,
- *Gaeumanomyces graminis* an Getreide,
- 5 • *Gibberella* arten an Getreide und Reis (z. B. *Gibberella fujikuroi* an Reis),
- *Grainstaining complex* an Reis,
- *Helminthosporium* Arten an Mais und Reis,
- *Microdochium nivale* an Getreide,
- *Mycosphaerella* Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen, wie z. B.
- 10 • *M. graminicola* an Weizen oder *M. fijiensis* an Bananen,
- *Peronospora*-Arten an Kohl und Zwiebelgewächsen, wie z. B. *P. brassicae* an Kohl oder *P. destructor* an Zwiebel,
- *Phakopsara pachyrhizi* und *Phakopsara meibomiaae* an Sojabohnen,
- *Phomopsis* Arten an Sojabohnen und Sonnenblumen,
- 15 • *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Phytophthora* Arten an verschiedenen Pflanzen wie z. B. *P. capsici* an Paprika,
- *Plasmopara viticola* an Weinreben,
- *Podosphaera leucotricha* an Apfel,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Getreide,
- 20 • *Pseudoperonospora* an verschiedenen Pflanzen wie z. B. *P. cubensis* an Gurke oder *P. humili* an Hopfen,
- *Puccinia* Arten an verschiedenen Pflanzen wie z. B. *P. triticina*, *P. striiformis*, *P. hordei* oder *P. graminis* an Getreide, oder *P. asparagi* an Spargel,
- *Pyricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Entyloma oryzae*, an Reis,
- 25 • *Pyricularia grisea* an Rasen und Getreide,
- *Pythium spp.* an Rasen, Reis, Mais, Baumwolle, Raps, Sonnenblumen, Zuckerrüben, Gemüse und anderen Pflanzen wie z. B. *P. ultimum* an verschiedenen Pflanzen, *P. aphanidermatum* an Rasen,
- 30 • *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis, Kartoffeln, Rasen, Mais, Raps, Kartoffeln, Zuckerrüben, Gemüse und an verschiedenen Pflanzen wie z. B. *R. solani* an Rüben und verschiedenen Pflanzen,
- *Rhynchosporium secalis* an Gerste, Roggen und Triticale,
- *Sclerotinia* Arten an Raps und Sonnenblumen,
- 35 • *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Erysiphe* (syn. *Uncinula*) *necator* an Weinrebe,
- *Setospaeria* Arten an Mais und Rasen,
- *Sphacelotheca reilinia* an Mais,
- *Thievaliopsis* Arten an Sojabohnen und Baumwolle,
- 40 • *Tilletia* Arten an Getreide,

- *Ustilago*-Arten an Getreide, Mais und Zuckerrohr, wie z. B. *U. maydis* an Mais,
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen wie z. B. *V. inaequalis* an Apfel.

Insbesondere eignen sie sich zur Bekämpfung von Schadpilzen aus der Klasse der
5 Peronosporomycetes (syn.Oomyceten), wie Peronospora-Arten, Phytophthora-Arten,
Plasmopara viticola , Pseudoperonospora-Arten und Pythium-Arten.

Darüber hinaus können die erfindungsgemäßen Verbindungen auch in Kulturen, die
durch Züchtung, einschließlich gentechnischer Methoden, gegen Insekten- oder Pilzbe-
10 fall tolerant sind, verwendet werden.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen im Mate-
rialschutz (z. B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und
im Vorratsschutz. Im Holzschutz finden insbesondere folgende Schadpilze Beachtung:
15 Ascomyceten wie Ophiostoma spp., Ceratocystis spp., Aureobasidium pullulans, Sclero-
phoma spp., Chaetomium spp., Humicola spp., Petriella spp., Trichurus spp.; Basidi-
omyceten wie Coniophora spp., Coriolus spp., Gloeophyllum spp., Lentinus spp., Pleu-
rotus spp., Poria spp., Serpula spp. und Tyromyces spp., Deuteromyceten wie Asper-
gillus spp., Cladosporium spp., Penicillium spp., Trichoderma spp., Alternaria spp.,
20 Paecilomyces spp. und Zygomyceten wie Mucor spp., darüber hinaus im Material-
schutz folgende Hefepilze: Candida spp. und Saccharomyces cerevisiae.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu
schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid
25 wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch
nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

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

30

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

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis
35 1000 g/100 kg, vorzugsweise 5 bis 100 g/100 kg Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an
Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Auf-

wandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen der Formel I können in verschiedenen Kristallmodifikationen vorlie-
5 gen, die sich in der biologischen Wirksamkeit unterscheiden können. Sie sind ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

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

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Verstrecken
15 des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

Wasser, aromatische Lösungsmittel (z. B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z. B.
20 Erdölfraktionen), Alkohole (z. B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z. B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,

25 Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z. B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z. B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z. B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

30 Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des
35 Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxy-

liertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

- 5 Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z. B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z. B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

15

Granulate, z. B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z. B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z. B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nussschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

- 25 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

- 30 Beispiele für Formulierungen sind:

1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A Wasserlösliche Konzentrate (SL, LS)

- 35 10 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden mit 90 Gew.-Teilen Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff. Man erhält auf diese Weise eine Formulierung mit 10 Gew.-% Wirkstoffgehalt.

B Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in 70 Gew.-Teilen Cyclohexanon unter Zusatz von 10 Gew.-Teilen eines Dispergiermittels z. B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion. Der Wirkstoffgehalt beträgt 20 Gew.-%

5

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in 75 Gew.-Teilen Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 Gew.-Teile) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion. Die Formulierung hat 15 Gew.-%

10 Wirkstoffgehalt.

D Emulsionen (EW, EO, ES)

25 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in 35 Gew.-Teile Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 Gew.-Teile) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (z. B. Ultraturax) in 30 Gew.-Teile Wasser gegeben und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion. Die Formulierung hat einen Wirkstoffgehalt von 25 Gew.-%.

15

E Suspensionen (SC, OD, FS)

20 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden unter Zusatz von 10 Gew.-Teilen Dispergier- und Netzmitteln und 70 Gew.-Teilen Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs. Der Wirkstoffgehalt in der Formulierung beträgt 20 Gew.-% .

25

F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

50 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden unter Zusatz von 50 Gew.-Teilen Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z. B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs. Die Formulierung hat einen Wirkstoffgehalt von 50 Gew.-%.

30

G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP, SS, WS)

75 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden unter Zusatz von 25 Gew.-Teilen Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator-Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs. Der Wirkstoffgehalt der Formulierung beträgt 75 Gew.-%.

35

H Gelformulierungen (GF)

In einer Kugelmühle werden 20 Gew.-Teile der Wirkstoffe, 10 Gew.-Teile Dispergiermittel, 1Gew.-Teil Quellmittel ("gelling agent") und 70 Gew.-Teile Wasser oder eines organischen Lösungsmittels zu einer feinen Suspension vermahlen. Bei der Verdünnung mit Wasser ergibt sich eine stabile Suspension mit 20 Gew.-% Wirkstoffgehalt.

2. Produkte für die Direktapplikation

I Stäube (DP, DS)

5 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden fein gemahlen und mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel mit 5 Gew.-% Wirkstoffgehalt.

J Granulate (GR, FG, GG, MG)

0,5 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden fein gemahlen und mit 99,5 Gewichtsteilen Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation mit 0,5 Gew.-% Wirkstoffgehalt.

K ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in 90 Gew.-Teilen eines organischen Lösungsmittel z. B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation mit 10 Gew.-% Wirkstoffgehalt.

Für die Saatgutbehandlung werden üblicherweise wasserlösliche Konzentrate (LS), Suspensionen (FS), Stäube (DS), wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WS, SS), Emulsionen (ES), emulgierbare Konzentrate (EC) und Gelformulierungen (GF) verwendet. Diese Formulierungen können auf das Saatgut unverdünnt oder, bevorzugt, verdünnt angewendet werden. Die Anwendung kann vor der Aussaat erfolgen.

30

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z. B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

35

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netz-
baren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet wer-
den. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Sub-
stanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,
5 Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber
auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und even-
tuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Ver-
dünnung mit Wasser geeignet sind.

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

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

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide,
Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch
20 erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können
zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1 : 100 bis 100 : 1, bevorzugt
1 : 10 bis 10 : 1 zugemischt werden.

Als Adjuvants in diesem Sinne kommen insbesondere in Frage: organisch modifizierte
25 Polysiloxane, z. B. Break Thru S 240®; Alkoholalkoxylate, z. B. Atplus 245®, Atplus
MBA 1303®, Plurafac LF 300® und Lutensol ON 30®; EO-PO-Blockpolymerisate, z. B.
Pluronic RPE 2035® und Genapol B®; Alkoholethoxylate, z. B. Lutensol XP 80®; und
Natriumdioctylsulfosuccinat, z. B. Leophen RA®.

30 Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zu-
sammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z. B. mit Herbiziden, Insektiziden,
Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der
Verbindungen (I) bzw. der sie enthaltenden Mittel mit einem oder mehreren weiteren
Wirkstoffen, insbesondere Fungiziden, kann beispielsweise in vielen Fällen das Wir-
35 kungsspektrum verbreitert werden oder Resistenzentwicklungen vorgebeugt werden. In
vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte.

Die vorliegende Erfindung betrifft daher auch eine Kombination aus mindestens einer
erfindungsgemäß verwendeten Verbindung der Formel I und/oder einem landwirt-

schaftlich verträglichen Salz davon und mindestens einem weiteren fungiziden, insektiziden, herbiziden und/oder wachstumsregulierenden Wirkstoff.

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

Strobilurine

- Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Enestroburin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metomi-
10 nostrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin, Trifloxystrobin, Orysastrobin, (2-Chlor-5-[1-(3-methylbenzyloxyimino)-ethyl]-benzyl)-carbaminsäuremethylester, (2-Chlor-5-[1-(6-methyl-pyridin-2-ylmethoxyimino)-ethyl]-benzyl)-carbaminsäuremethylester, 2-(ortho-(2,5-Dimethylphenyloxymethylen)phenyl)-3-methoxyacrylsäuremethylester;

15 Carbonsäureamide

- Carbonsäureanilide: Benalaxyl, Benodanil, Boscalid, Carboxin, Mepronil, Fenfuram, Fenhexamid, Flutolanil, Furametpyr, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl, Oxycarboxin, Penthiopyrad, Thifluzamide, Tiadinil, 4-Difluormethyl-2-methyl-thiazol-5-carbonsäure-(4'-brom-biphenyl-2-yl)-amid, 4-Difluormethyl-2-methyl-thiazol-5-carbonsäure-
20 (4'-trifluormethyl-biphenyl-2-yl)-amid, 4-Difluormethyl-2-methyl-thiazol-5-carbonsäure-(4'-chlor-3'-fluor-biphenyl-2-yl)-amid, 3-Difluormethyl-1-methyl-pyrazol-4-carbonsäure-(3',4'-dichlor-4-fluor-biphenyl-2-yl)-amid, 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-(2-cyano-phenyl)-amid;
- Carbonsäuremorpholide: Dimethomorph, Flumorph;
- 25 - Benzoessäureamide: Flumetover, Fluopicolide (Picobenzamid), Zoxamide;
- Sonstige Carbonsäureamide: Carpropamid, Diclocymet, Mandipropamid, N-(2-(4-[3-(4-Chlor-phenyl)-prop-2-inyloxy]-3-methoxy-phenyl)-ethyl)-2-methansulfonylamino-3-methyl-butylamid, N-(2-(4-[3-(4-Chlor-phenyl)-prop-2-inyloxy]-3-methoxy-phenyl)-ethyl)-2-ethansulfonylamino-3-methyl-butylamid;

30

Azole

- Triazole: Bitertanol, Bromuconazole, Cyproconazole, Difenoconazole, Diniconazole, Enilconazole, Epoxiconazole, Fenbuconazole, Flusilazole, Fluquinconazole, Flutriafol, Hexaconazol, Imibenconazole, Ipconazole, Metconazol, Myclobutanil, Penconazole, Propiconazole, Prothioconazole, Simeconazole, Tebuconazole, Tetraconazole, Triadimenol, Triadimefon, Triticonazole;
- 35 - Imidazole: Cyazofamid, Imazalil, Pefurazoate, Prochloraz, Triflumizole;
- Benzimidazole: Benomyl, Carbendazim, Fuberidazole, Thiabendazole;
- Sonstige: Ethaboxam, Etridiazole, Hymexazole;

40

Stickstoffhaltige Heterocyclenverbindungen

- Pyridine: Fluazinam, Pyrifenox, 3-[5-(4-Chlor-phenyl)-2,3-dimethyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin;
- Pyrimidine: Bupirimate, Cyprodinil, Ferimzone, Fenarimol, Mepanipyrim, Nuarimol, 5 Pyrimethanil;
- Piperazine: Triforine;
- Pyrrole: Fludioxonil, Fenpiclonil;
- Morpholine: Aldimorph, Dodemorph, Fenpropimorph, Tridemorph;
- Dicarboximide: Iprodione, Procymidone, Vinclozolin;
- 10 - Sonstige: Acibenzolar-S-methyl, Anilazin, Captan, Captafol, Dazomet, Diclomezine, Fenoxanil, Folpet, Fenpropidin, Famoxadone, Fenamidone, Octhilinone, Probenazole, Proquinazid, Pyroquilon, Quinoxifen, Tricyclazole, 5-Chlor-7-(4-methyl-piperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluor-phenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin, 2-Butoxy-6-iodo-3-propyl-chromen-4-on, 3-(3-Brom-6-fluoro-2-methyl-indol-1-sulfonyl)-[1,2,4]triazol-1-
- 15 sulfonsäuredimethylamid;

Carbamate und Dithiocarbamate

- Dithiocarbamate: Ferbam, Mancozeb, Maneb, Metiram, Metam, Propineb, Thiram, Zineb, Ziram;
- 20 - Carbamate: Diethofencarb, Flubenthiavalicarb, Iprovalicarb, Propamocarb, 3-(4-Chlor-phenyl)-3-(2-isopropoxycarbonylamino-3-methyl-butyrylamino)-propionsäuremethylester, N-(1-(1-(4-cyanophenyl)ethansulfonyl)-but-2-yl) carbaminsäure-(4-fluorphenyl)ester;

25 Sonstige Fungizide

- Guanidine: Dodine, Iminoctadine, Guazatine;
- Antibiotika: Kasugamycin, Polyoxine, Streptomycin, Validamycin A;
- Organometallverbindungen: Fentin Salze;
- Schwefelhaltige Heterocyclenverbindungen: Isoprothiolane, Dithianon;
- 30 - Organophosphorverbindungen: Edifenphos, Fosetyl, Fosetyl-aluminium, Iprobenfos, Pyrazophos, Tolclofos-methyl, Phosphorige Säure und ihre Salze;
- Organochlorverbindungen: Thiophanate Methyl, Chlorothalonil, Dichlofluanid, Tolyfluanid, Flusulfamide, Phthalide, Hexachlorbenzene, Pencycuron, Quintozene;
- Nitrophenyl-derivate: Binapacryl, Dinocap, Dinobuton;
- 35 - Anorganische Wirkstoffe: Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferhydroxid, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat, Schwefel;
- Sonstige: Spiroxamine, Cyflufenamid, Cymoxanil, Metrafenone.

40 Demgemäß betrifft die vorliegenden Erfindung ferner die in der Tabelle B aufgeführten Zusammensetzungen, wobei jeweils eine Zeile der Tabelle B einer fungiziden Zusammensetzung entspricht, umfassend eine Verbindung der Formel I (Komponente 1),

- welche insbesondere eine der hierin als bevorzugt beschriebenen Verbindungen ist, und den jeweils in der betreffenden Zeile angegebenen weiteren Wirkstoff (Komponente 2). Gemäß einer Ausgestaltung der Erfindung ist Komponente 1 in jeder Zeile der Tabelle B jeweils eine der in den Tabellen 1 bis 462 spezifisch individualisierten Verbindungen der Formel I.

Tabelle B

Nr.	Komponente 1	Komponente 2
B-1	eine Verbindung der Formel I	Azoxystrobin
B-2	eine Verbindung der Formel I	Dimoxystrobin
B-3	eine Verbindung der Formel I	Enestroburin
B-4	eine Verbindung der Formel I	Fluoxastrobin
B-5	eine Verbindung der Formel I	Kresoxim-methyl
B-6	eine Verbindung der Formel I	Metominostrobin
B-7	eine Verbindung der Formel I	Picoxystrobin
B-8	eine Verbindung der Formel I	Pyraclostrobin
B-9	eine Verbindung der Formel I	Trifloxystrobin
B-10	eine Verbindung der Formel I	Orysastrobin
B-11	eine Verbindung der Formel I	(2-Chlor-5-[1-(3-methyl-benzyloxyimino)-ethyl]-benzyl)-carbaminsäuremethylester
B-12	eine Verbindung der Formel I	(2-Chlor-5-[1-(6-methyl-pyridin-2-ylmethoxyimino)-ethyl]-benzyl)-carbaminsäuremethylester
B-13	eine Verbindung der Formel I	2-(ortho-(2,5-Dimethylphenyl-oxymethylen)-phenyl)-3-methoxy-acrylsäuremethylester
B-14	eine Verbindung der Formel I	Benalaxyl
B-15	eine Verbindung der Formel I	Benodanil
B-16	eine Verbindung der Formel I	Boscalid
B-17	eine Verbindung der Formel I	Carboxin
B-18	eine Verbindung der Formel I	Mepronil
B-19	eine Verbindung der Formel I	Fenfuram
B-20	eine Verbindung der Formel I	Fenhexamid
B-21	eine Verbindung der Formel I	Flutolanil
B-22	eine Verbindung der Formel I	Furametpyr
B-23	eine Verbindung der Formel I	Metalaxyl
B-24	eine Verbindung der Formel I	Ofurace
B-25	eine Verbindung der Formel I	Oxadixyl
B-26	eine Verbindung der Formel I	Oxycarboxin
B-27	eine Verbindung der Formel I	Penthiopyrad

Nr.	Komponente 1	Komponente 2
B-28	eine Verbindung der Formel I	Thifluzamide
B-29	eine Verbindung der Formel I	Tiadinil
B-30	eine Verbindung der Formel I	4-Difluormethyl-2-methyl-thiazol-5-carbonsäure-(4'-brom-biphenyl-2-yl)-amid
B-31	eine Verbindung der Formel I	4-Difluormethyl-2-methyl-thiazol-5-carbonsäure-(4'-trifluormethyl-biphenyl-2-yl)-amid
B-32	eine Verbindung der Formel I	4-Difluormethyl-2-methyl-thiazol-5-carbonsäure-(4'-chlor-3'-fluor-biphenyl-2-yl)-amid
B-33	eine Verbindung der Formel I	3-Difluormethyl-1-methyl-pyrazol-4-carbonsäure-(3',4'-dichlor-4-fluor-biphenyl-2-yl)-amid
B-34	eine Verbindung der Formel I	3-Difluormethyl-1-methyl-pyrazol-4-carbonsäure-(3',4'-dichlor-5-fluor-biphenyl-2-yl)-amid
B-35	eine Verbindung der Formel I	3,4-Dichlorisothiazol-5-carbonsäure-(2-cyanophenyl)-amid
B-36	eine Verbindung der Formel I	Dimethomorph
B-37	eine Verbindung der Formel I	Flumorph
B-38	eine Verbindung der Formel I	Flumetover
B-39	eine Verbindung der Formel I	Fluopicolide (Picobenzamid)
B-40	eine Verbindung der Formel I	Zoxamide
B-41	eine Verbindung der Formel I	Carpropamid
B-42	eine Verbindung der Formel I	Diclocymet
B-43	eine Verbindung der Formel I	Mandipropamid
B-44	eine Verbindung der Formel I	N-(2-(4-[3-(4-Chlor-phenyl)-prop-2-inyloxy]-3-methoxy-phenyl)-ethyl)-2-methansulfonylamino-3-methyl-butyramid
B-45	eine Verbindung der Formel I	N-(2-(4-[3-(4-Chlor-phenyl)-prop-2-inyloxy]-3-methoxy-phenyl)-ethyl)-2-ethansulfonylamino-3-methyl-butyramid
B-46	eine Verbindung der Formel I	Bitertanol
B-47	eine Verbindung der Formel I	Bromuconazole
B-48	eine Verbindung der Formel I	Cyproconazole
B-49	eine Verbindung der Formel I	Difenoconazole
B-50	eine Verbindung der Formel I	Diniconazole
B-51	eine Verbindung der Formel I	Enilconazole
B-52	eine Verbindung der Formel I	Epoconazole
B-53	eine Verbindung der Formel I	Fenbuconazole
B-54	eine Verbindung der Formel I	Flusilazole

Nr.	Komponente 1	Komponente 2
B-55	eine Verbindung der Formel I	Fluquinconazole
B-56	eine Verbindung der Formel I	Flutriafol
B-57	eine Verbindung der Formel I	Hexaconazol
B-58	eine Verbindung der Formel I	Imibenconazole
B-59	eine Verbindung der Formel I	Ipconazole
B-60	eine Verbindung der Formel I	Metconazol
B-61	eine Verbindung der Formel I	Myclobutanil
B-62	eine Verbindung der Formel I	Penconazole
B-63	eine Verbindung der Formel I	Propiconazole
B-64	eine Verbindung der Formel I	Prothioconazole
B-65	eine Verbindung der Formel I	Simeconazole
B-66	eine Verbindung der Formel I	Tebuconazole
B-67	eine Verbindung der Formel I	Tetraconazole
B-68	eine Verbindung der Formel I	Triadimenol
B-69	eine Verbindung der Formel I	Triadimefon
B-70	eine Verbindung der Formel I	Triticonazole
B-71	eine Verbindung der Formel I	Cyazofamid
B-72	eine Verbindung der Formel I	Imazalil
B-73	eine Verbindung der Formel I	Pefurazoate
B-74	eine Verbindung der Formel I	Prochloraz
B-75	eine Verbindung der Formel I	Triflumizole
B-76	eine Verbindung der Formel I	Benomyl
B-77	eine Verbindung der Formel I	Carbendazim
B-78	eine Verbindung der Formel I	Fuberidazole
B-79	eine Verbindung der Formel I	Thiabendazole
B-80	eine Verbindung der Formel I	Ethaboxam
B-81	eine Verbindung der Formel I	Etridiazole
B-82	eine Verbindung der Formel I	Hymexazole
B-83	eine Verbindung der Formel I	Fluazinam
B-84	eine Verbindung der Formel I	Pyrifenox
B-85	eine Verbindung der Formel I	3-[5-(4-Chlor-phenyl)-2,3-dimethyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin
B-86	eine Verbindung der Formel I	Bupirimate
B-87	eine Verbindung der Formel I	Cyprodinil
B-88	eine Verbindung der Formel I	Ferimzone
B-89	eine Verbindung der Formel I	Fenarimol
B-90	eine Verbindung der Formel I	Mepanipyrim
B-91	eine Verbindung der Formel I	Nuarimol
B-92	eine Verbindung der Formel I	Pyrimethanil

Nr.	Komponente 1	Komponente 2
B-93	eine Verbindung der Formel I	Triforine
B-94	eine Verbindung der Formel I	Fludioxonil
B-95	eine Verbindung der Formel I	Fenpiclonil
B-96	eine Verbindung der Formel I	Aldimorph
B-97	eine Verbindung der Formel I	Dodemorph
B-98	eine Verbindung der Formel I	Fenpropimorph
B-99	eine Verbindung der Formel I	Tridemorph
B-100	eine Verbindung der Formel I	Iprodione
B-101	eine Verbindung der Formel I	Procymidone
B-102	eine Verbindung der Formel I	Vinclozolin
B-103	eine Verbindung der Formel I	Acibenzolar-S-methyl
B-104	eine Verbindung der Formel I	Anilazin
B-105	eine Verbindung der Formel I	Captan
B-106	eine Verbindung der Formel I	Captafol
B-107	eine Verbindung der Formel I	Dazomet;
B-108	eine Verbindung der Formel I	Diclomezine
B-109	eine Verbindung der Formel I	Fenoxanil
B-110	eine Verbindung der Formel I	Folpet
B-111	eine Verbindung der Formel I	Fenpropidin
B-112	eine Verbindung der Formel I	Famoxadone
B-113	eine Verbindung der Formel I	Fenamidone
B-114	eine Verbindung der Formel I	Octhilinone
B-115	eine Verbindung der Formel I	Probenazole
B-116	eine Verbindung der Formel I	Proquinazid
B-117	eine Verbindung der Formel I	Pyroquilon
B-118	eine Verbindung der Formel I	Quinoxifen
B-119	eine Verbindung der Formel I	Tricyclazole
B-120	eine Verbindung der Formel I	5-Chlor-7-(4-methyl-piperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluor-phenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin
B-121	eine Verbindung der Formel I	2-Butoxy-6-iodo-3-propyl-chromen-4-on
B-122	eine Verbindung der Formel I	3-(3-Brom-6-fluoro-2-methyl-indol-1-sulfonyl)-[1,2,4]triazol-1-sulfonsäuredimethylamid
B-123	eine Verbindung der Formel I	Ferbam
B-124	eine Verbindung der Formel I	Mancozeb
B-125	eine Verbindung der Formel I	Maneb
B-126	eine Verbindung der Formel I	Metiram
B-127	eine Verbindung der Formel I	Metam

Nr.	Komponente 1	Komponente 2
B-128	eine Verbindung der Formel I	Propineb
B-129	eine Verbindung der Formel I	Thiram
B-130	eine Verbindung der Formel I	Zineb
B-131	eine Verbindung der Formel I	Ziram
B-132	eine Verbindung der Formel I	Diethofencarb
B-133	eine Verbindung der Formel I	Flubenthiavalicarb
B-134	eine Verbindung der Formel I	Iprovalicarb
B-135	eine Verbindung der Formel I	Propamocarb
B-136	eine Verbindung der Formel I	3-(4-Chlor-phenyl)-3-(2-isopropoxycarbonyl-amino-3-methyl-butrylamino)-propion-säuremethylester
B-137	eine Verbindung der Formel I	N-(1-(1-(4-cyanophenyl)ethansulfonyl)-but-2-yl) carbaminsäure-(4-fluorphenyl)ester
B-138	eine Verbindung der Formel I	Dodine
B-139	eine Verbindung der Formel I	Iminoctadine
B-140	eine Verbindung der Formel I	Guazatine
B-141	eine Verbindung der Formel I	Kasugamycin
B-142	eine Verbindung der Formel I	Polyoxine
B-143	eine Verbindung der Formel I	Streptomycin
B-144	eine Verbindung der Formel I	Validamycin A
B-145	eine Verbindung der Formel I	Fentin Salze
B-146	eine Verbindung der Formel I	Isoprothiolane
B-147	eine Verbindung der Formel I	Dithianon
B-148	eine Verbindung der Formel I	Edifenphos
B-149	eine Verbindung der Formel I	Fosetyl
B-150	eine Verbindung der Formel I	Fosetyl-aluminium
B-151	eine Verbindung der Formel I	Iprobenfos
B-152	eine Verbindung der Formel I	Pyrazophos
B-153	eine Verbindung der Formel I	Tolclofos-methyl
B-154	eine Verbindung der Formel I	Phosphorige Säure und ihre Salze
B-155	eine Verbindung der Formel I	Thiophanate Methyl
B-156	eine Verbindung der Formel I	Chlorothalonil
B-157	eine Verbindung der Formel I	Dichlofluanid
B-158	eine Verbindung der Formel I	Tolyfluanid
B-159	eine Verbindung der Formel I	Flusulfamide
B-160	eine Verbindung der Formel I	Phthalide
B-161	eine Verbindung der Formel I	Hexachlorbenzene
B-162	eine Verbindung der Formel I	Pencycuron
B-163	eine Verbindung der Formel I	Quintozene

Nr.	Komponente 1	Komponente 2
B-164	eine Verbindung der Formel I	Binapacryl
B-165	eine Verbindung der Formel I	Dinocap
B-166	eine Verbindung der Formel I	Dinobuton
B-167	eine Verbindung der Formel I	Bordeaux Brühe
B-168	eine Verbindung der Formel I	Kupferacetat
B-169	eine Verbindung der Formel I	Kupferhydroxid
B-170	eine Verbindung der Formel I	Kupferoxychlorid
B-171	eine Verbindung der Formel I	basisches Kupfersulfat
B-172	eine Verbindung der Formel I	Schwefel
B-173	eine Verbindung der Formel I	Spiroxamin
B-174	eine Verbindung der Formel I	Cyflufenamid
B-175	eine Verbindung der Formel I	Cymoxanil
B-176	eine Verbindung der Formel I	Metrafenon

Die voranstehend als Komponente 2 genannten Wirkstoffe II, ihre Herstellung und ihre Wirkung gegen Schadpilze sind allgemein bekannt (vgl.:

<http://www.hclrss.demon.co.uk/index.html>); sie sind kommerziell erhältlich. Die nach

5 IUPAC benannten Verbindungen, ihre Herstellung und ihre fungizide Wirkung sind ebenfalls bekannt und beispielsweise in der EP-A 226 917; EP-A 10 28 125; EP-A 10 35 122; EP-A 12 01 648; WO 98/46608; WO 99/24413; WO 03/14103; WO 03/053145; WO 03/066609 und WO 04/049804 beschrieben, worauf hiermit in vollem Umfang Bezug genommen wird.

10

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I sind außerdem zur Bekämpfung von arthropoden Pflanzenschädlingen, insbesondere pflanzenschädigenden Insekten und Arachniden geeignet. Weiterhin eignen sich die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I zur Bekämpfung von Nematoden.

15

Beispiele für pflanzenschädigende Arthropoden sind Insekten

- der Ordnung *Lepidoptera*, z. B. *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliiothis armigera*, *Heliiothis virescens*, *Heliiothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*,
- 20
- 25

- Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancarдела*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*,
Lyonetia clerkella, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*,
5 *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*,
Plathypena scabra, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera eridania*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumato-
poea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* und *Zeiraphera canadensis*,
10
- der Ordnung Coleoptera (beetles), z. B. *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*,
Bruchus rufimanus, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida
15 nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*,
Chaetocnema tibialis, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*,
20 *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga* sp., *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* und *Sitophilus granaria*,
25
 - der Ordnung Diptera, z. B. *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*,
30 *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platyura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*,
Lucilia caprina, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*, *Tipula oleracea* und *Tipula paludosa*,
35
 - der Ordnung Thysanoptera (thrips), z. B. *Dichromothrips* spp., *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* und *Thrips tabaci*,
40

- der Ordnung Hymenoptera z. B. *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* und *Solenopsis invicta*,
- 5 • der Ordnung Heteroptera, z. B. *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis* und *Thyanta perditor*,
- 10 • der Ordnung Homoptera, z. B. *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisa tabaci*, *Bemisa argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*,
- 15 *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis*
- 20 *pyrarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursaarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalosiphum ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*,
- 25 *Sitobion avenae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, und *Viteus vitifolii*,
- der Ordnung Isoptera (Termiten), z. B. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* und *Termes natalensis*, and
- 30 • der Ordnung Orthoptera, z. B. *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*,
- 35 *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* and *Tachycines asynamorus*.

Die Verbindungen der Formel I und ihre Salze eignen sich auch zur Bekämpfung von Arachniden (Arachnoidea), wie Acaria (Acarina), beispielsweise der Familien Argasidae, Ixodidae and Sarcoptidae, such as *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus micro-*

- plus, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, und *Eriophyidae* spp. wie *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* und *Eriophyes sheldoni*; Tarsonemidae spp. wie *Phytonemus pallidus* und *Polyphagotarsonemus latus*; Tenuipalpidae spp. wie *Brevipalpus phoenicis*; Tetranychidae spp. such as *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* und *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, und *Oligonychus pratensis*.
- 5
- 10 Die Verbindungen der Formel I und ihre Salze eignen sich auch zur Bekämpfung von Nematoden, beispielsweise Wurzelgallen Nematoden, z. B. *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, Zysten-bildenden Nematoden, z. B. *Globodera rostochiensis*, *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, stem and Blatt-Nematoden, z. B. *Belonolaimus longicaudatus*, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci*, *Heliocotylenchus multicinctus*, *Longidorus elongatus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchus robustus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus* und *Pratylenchus goodeyi*.
- 15
- 20 Demnach betrifft die Erfindung auch ein Verfahren zur Bekämpfung der vorgenannten tierischen Schädlinge, bei dem man die tierischen Pflanzenschädlinge oder die vor Befall mit diesen Schadorganismen zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer wirksamen Menge der Verbindungen der Formel I oder ihrer Salze behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach dem Befall der
- 25 Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Schadorganismen erfolgen.

Die 5-Hetarylpyrimidine der allgemeinen Formel I, insbesondere die in der vorhergehenden Beschreibung als bevorzugt beschriebenen 5-Hetarylpyrimidine der Formel I, und deren pharmazeutisch geeigneten Salze inhibieren effektiv das Wachstum

30 und/oder die Vermehrung von Tumorzellen, wie dies in Standardtests an Tumorzelllinien, wie HeLa, MCF-7 und COLO 205, gezeigt werden kann. Insbesondere zeigen die erfindungsgemäßen Pyrimidine der Formel I im Allgemeinen IC_{50} -Werte $< 10^{-6}$ mol/l (d. h. $< 1 \mu\text{M}$), vorzugsweise IC_{50} -Werte $< 10^{-7}$ mol/l (d. h. $< 100 \text{ nM}$) für Zellzyklusinhibition in HeLa Zellen. Die 5-Hetarylpyrimidine der Formel I, insbesondere die in der

35 vorhergehenden Beschreibung als bevorzugt beschriebenen erfindungsgemäßen 5-Hetarylpyrimidine der Formel I und deren pharmazeutisch geeigneten Salze sind daher für die Behandlung, Inhibition oder Kontrolle des Wachstums und/oder der Vermehrung von Tumorzellen und damit verbundenen Erkrankungen geeignet. Dementsprechend sind sie für die Krebstherapie bei warmblütigen Wirbeltieren, d. h. von Säugetie-

ren und Vögeln, insbesondere bei Menschen, aber auch bei anderen Säugetieren, insbesondere bei Nutz- und Haustieren wie Hund, Katze, Schwein, Wiederkäuer (Rind, Schaf, Ziege, Bison etc.), Pferd und Vögel wie Huhn, Truthahn, Ente, Gans, Perlhuhn und dergleichen, geeignet.

5

Insbesondere sind 5-Hetarylpyrimidine der Formel I, vor allem die in der vorhergehenden Beschreibung als bevorzugt beschriebenen erfindungsgemäßen 5-Hetarylpyrimidine der Formel I, und deren pharmazeutisch geeigneten Salze für die Therapie von Krebs oder krebsartigen Erkrankungen der folgenden Organe geeignet: Brust,

10

Lunge, Darm, Prostata, Haut (Melanom), Niere, Blase, Mund, Larynx, Speiseröhre, Magen, Ovarien, Bauchspeicheldrüse, Leber und Gehirn.

15

Die Erfindung betrifft ferner die pharmazeutische Verwendung der 5-Hetarylpyrimidine der Formel I und deren pharmazeutisch geeigneten Salze, insbesondere die Verwendung der als bevorzugt beschriebenen 5-Hetarylpyrimidine der Formel I und deren pharmazeutisch geeigneten Salze, und speziell deren Verwendung zur Herstellung eines Medikaments zur Behandlung von Krebs.

20

Weiterhin betrifft die vorliegende Erfindung eine pharmazeutische Zusammensetzung, die wenigstens ein 5-Hetarylpyrimidin der Formel I und/oder ein pharmazeutisch verträgliches Salz davon und gegebenenfalls wenigstens einen pharmazeutisch verträglichen Träger enthält. Hierunter sind insbesondere solche pharmazeutischen Zusammensetzungen bevorzugt, die wenigstens ein erfindungsgemäßes (d. h. neues) 5-Hetarylpyrimidin der Formel I und/oder ein pharmazeutisch geeignetes Salz davon enthalten. Hierunter sind ebenfalls insbesondere solche pharmazeutischen Zusammensetzungen bevorzugt, die wenigstens eines zuvor als bevorzugt genanntes 5-Hetarylpyrimidin der Formel I und/oder ein pharmazeutisch geeignetes Salz davon enthalten.

25

30

Die erfindungsgemäßen pharmazeutischen Zusammensetzungen enthalten neben einem 5-Hetarylpyrimidin der Formel I und/oder einem pharmazeutisch geeigneten Salz davon gegebenenfalls wenigstens einen geeigneten Träger. Geeignete Träger sind beispielsweise die für pharmazeutische Formulierungen üblicherweise verwendeten Lösungsmittel, Träger, Excipienten, Bindemittel und dergleichen, die nachstehend für einzelne Verabreichungsarten beispielhaft beschrieben werden.

35

Die erfindungsgemäßen bzw. erfindungsgemäß verwendeten Verbindungen der Formel I können auf übliche Weise verabreicht werden, z. B. oral, intravenös, intramuskulär oder subkutan. Für die orale Verabreichung kann der Wirkstoff beispielsweise mit einem inerten Verdünnungsmittel oder mit einem essbaren Träger gemischt werden; er

kann in eine harte oder weiche Gelatinekapsel eingebettet, zu Tabletten gepresst oder direkt mit dem Essen/Futter vermischt werden. Der Wirkstoff kann mit Excipienten gemischt und in Form unverdaulicher Tabletten, Bukkaltabletten, Pastillen, Pillen, Kapseln, Suspensionen, Säften, Sirups und dergleichen verabreicht werden. Solche Zubereitungen sollten wenigstens 0,1 % Wirkstoff enthalten. Die Zusammensetzung der Zubereitung kann natürlich variieren. Üblicherweise enthält sie 2 bis 60 Gew.-% Wirkstoff, bezogen auf das Gesamtgewicht der jeweiligen Zubereitung (Dosiereinheit). Bevorzugte Zubereitungen der erfindungsgemäßen bzw. erfindungsgemäß verwendeten Verbindung I enthalten 10 bis 1000 mg Wirkstoff pro orale Dosiereinheit.

Die Tabletten, Pastillen, Pillen, Kapseln und dergleichen können außerdem folgende Bestandteile enthalten: Bindemittel, wie Traganth, Acacia, Maisstärke oder Gelatine, Excipienten, wie Dicalciumphosphat, Zerfallsmittel, wie Maisstärke, Kartoffelstärke, Algininsäure und dergleichen, Gleitmittel, wie Magnesiumstearat, Süßungsmittel, wie Saccharose, Lactose, oder Saccharin, und/oder Geschmacksstoffe, wie Pfefferminze, Vanille und dergleichen. Kapseln können außerdem einen flüssigen Träger enthalten. Auch andere Stoffe, die die Beschaffenheit der Dosiereinheit verändern, können eingesetzt werden. Beispielsweise können Tabletten, Pillen und Kapseln mit Schellack, Zucker oder Gemischen davon überzogen werden. Sirups oder Säfte können neben dem Wirkstoff noch Zucker (oder andere Süßungsmittel), Methyl- oder Propylparaben als Konservierungsmittel, einen Farbstoff und/oder einen Geschmacksstoff enthalten. Natürlich müssen die Bestandteile der Wirkstoffzubereitungen in den eingesetzten Mengen pharmazeutisch rein und nichttoxisch sein. Des Weiteren können die Wirkstoffe als Zubereitungen mit kontrollierter Wirkstofffreisetzung, z. B. als Retard-Präparate, formuliert werden.

Die Wirkstoffe können auch parenteral oder intraperitoneal verabreicht werden. Lösungen oder Suspensionen der Wirkstoffe oder ihrer Salze können mit Wasser unter Verwendung geeigneter Netzmittel, wie Hydroxypropylcellulose, hergestellt werden. Dispersionen können auch mit Glycerin, flüssigen Polyethylenglykolen und Gemische davon in Ölen hergestellt werden. Häufig enthalten diese Zubereitungen außerdem ein Konservierungsmittel, um das Wachstum von Mikroorganismen zu verhindern.

Für Injektionen vorgesehenen Zubereitungen umfassen sterile wässrige Lösungen und Dispersionen sowie sterile Pulver zur Herstellung steriler Lösungen und Dispersionen. Die Zubereitung muss ausreichend flüssig sein, so dass sie injizierbar ist. Sie muss unter den Herstellungs- und Lagerbedingungen stabil sein und gegen die Kontamination mit Mikroorganismen geschützt sein. Beim Träger kann es sich um ein Lösungsmittel oder ein Dispersionsmedium handeln, z. B. um Wasser, Ethanol, Polyole (z. B.

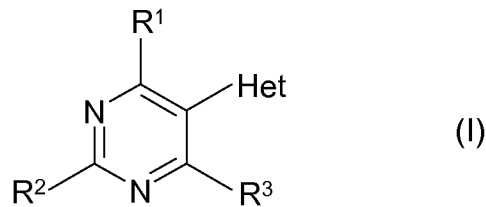
Glycerin, Propylenglykol oder flüssiges Polyethylenglykol), Gemische davon und/oder Pflanzenöle.

Herstellungsbeispiele

5

Patentansprüche

1. 5-Hetarylpyrimidine der allgemeinen Formel I



5

worin

R¹ für C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₁₀-Cycloalkyl oder C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, steht, und wobei die aliphatischen, alicyclischen Gruppen der Restdefinitionen von R¹ teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten L^{R1} tragen können:

L^{R1} Cyano, Cyanato (OCN), Nitro, Hydroxy, C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₁₀-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₃-C₁₀-Alkinyloxy, C₁-C₁₀-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₁₀-Alkenylcarbonyloxy, C₂-C₁₀-Alkynylcarbonyloxy, C₃-C₁₀-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, C₃-C₁₀-Cycloalkoxy, C₄-C₁₀-Cycloalkenyloxy, C₄-C₁₀-Alkadienyl, Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy, -C(=O)-A¹, -C(=O)-O-A¹, -C(=O)-N(A²)A¹, -C(=N-OA³)(NA²A¹), -C(=N-NA^{2a}A^{1a})(NA²A¹), C(=S)-A⁴, C(=S)-O-A¹, -C(=S)-NA²A¹, -N(A²)A¹, -N(A²)-C(=O)-A¹, -N(A³)-C(=O)-N(A²)A¹, -S(=O)_m-A⁴, -S(=O)_m-O-A¹ oder -S(=O)_m-N(A²)A¹, wobei zwei vicinale Substituenten L^{R1} auch zusammen für (=O) oder (=S) stehen können; wobei

25

m für 0, 1 oder 2 steht;

30

A¹, A^{1a}, A², A^{2a}, A³ und A⁴ unabhängig voneinander für H, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl oder Phenyl stehen;

35

A⁴ zusätzlich auch für Hydroxy, Amino, C₁-C₈-Alkylamino oder Di-(C₁-C₈-Alkyl)-amino stehen kann;

oder A¹ und A² und/oder A^{1a} und A^{2a} bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen vier-, fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromati-

schen Heterocyclus, der 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringlieder aufweist und 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringglieder enthalten kann;

5 oder L^{R1} steht für Phenyl, Naphthyl, einen 5-, 6-, 7-, 8-, 9- oder 10-gliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, der 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringlieder aufweist und 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringglieder enthalten kann;

10 wobei die aliphatischen, alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L^{R1} ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L¹¹ tragen können:

15 L¹¹ Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₄-C₈-Alkadienyl, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)-amino, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminothiocarbonyl oder Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl;

25 oder L¹¹ steht für C₃-C₁₀-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Bicycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkoxy; gesättigtes oder teilweise ungesättigtes C₃-C₁₀-Heterocyclyl oder C₃-C₁₀-Heterocyclyloxy, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, Hetaryloxy oder Hetarylthio, wobei die fünf letztgenannten Reste jeweils 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, S und N als Ringglieder aufweisen und 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringglieder enthalten können; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy oder Aryl-C₁-C₆-alkyl, wobei die Arylreste jeweils 6, 7, 8, 9 oder 10 Ringglieder aufweisen; und wobei die cyclischen Systeme durch 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene C₁-C₆-Alkyl- oder C₁-C₆-Halogenalkylreste substituiert sein können;

35 und wobei die aliphatischen, alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L¹¹ ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können;

40

- 5 R^2 für Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, N_3 , C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_3 - C_8 -Alkenyloxy, C_3 - C_8 -Alkinyloxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, oder für einen Rest der Formeln $C(=Z)OR^{21}$, $C(=Z)NR^{22}R^{23}$, $C(=Z)NR^{24}-NR^{22}R^{23}$, $C(=Z)R^{25}$, $CR^{26}R^{27}-OR^{28}$, $CR^{26}R^{27}-NR^{22}R^{23}$, $ON(=CR^{29}R^{30})$, $O-C(=Z)R^{25}$, $NR^{31}(C(=Z)R^{25})$, $NR^{31}(C(=Z)OR^{21})$, $NR^{31}(C(=Z)-NR^{22}R^{23})$, $NR^{32a}(N=CR^{29}R^{30})$, $NR^{32}NR^{22}R^{23}$, $NR^{32}OR^{21}$ oder $C(=N-Z'-R^{25})SR^{21}$ steht; wobei
- 10 Z für O, S, NR^{33} , NOR^{34} oder $N-NR^{35}R^{36}$ steht;
- 15 Z' für eine chemische Bindung, Sauerstoff, eine Carbonylgruppe, eine Gruppe NR^{32} oder eine der folgenden Gruppen: $-(C=O)-NH-$ oder $-(C=O)-O-$ steht, wobei die Carbonylgruppe an das Stickstoffatom gebunden ist;
- 20 R^{21} , R^{22} , R^{23} , R^{24} , R^{25} , R^{26} , R^{27} , R^{28} , R^{29} , R^{30} , R^{31} , R^{32} , R^{32a} , R^{33} , R^{34} , R^{35} und R^{36} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder C_4 - C_8 -Cycloalkenyl stehen;
- 25 R^{23a} bis auf Wasserstoff eine der für R^{21} angegebenen Bedeutungen aufweist;
- 30 R^{22} , R^{28} und R^{32} unabhängig voneinander zusätzlich auch $-CO-R^{25}$ bedeuten können;
- 35 R^{22} weiterhin $-CO-OR^{21}$ oder $-CO-NR^{23}R^{23b}$ bedeuten kann, wobei R^{23b} eine der für R^{21} angegebenen Bedeutungen aufweist;
- 40 R^{22} und R^{23} oder R^{22} und R^{23a} auch gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-, 5-, 6- oder 7-gliedrigen gesättigten oder teilweise ungesättigten Heterocyclus, der ein Sauerstoffatom als Ringglied aufweisen kann und/oder eine Doppelbindung enthalten kann, bilden können;
- R^{31} , R^{32} , R^{32a} , R^{33} , R^{34} oder R^{35} mit einem weiteren Rest R^{21} , R^{22} , R^{23} , R^{24} , R^{25} oder R^{31} auch gemeinsam eine C_1 - C_6 -Alkylengruppe bilden können, die im Falle von C_2 - C_6 -Alkylen eine Doppelbindung aufweisen kann;

R^{26} und R^{22} , R^{26} und R^{27} , R^{26} und R^{28} oder R^{29} und R^{30} auch gemeinsam eine C_3 - C_6 -Alkylengruppe bilden können, wobei der hieraus erhaltene Ring ein Sauerstoffatom als Ringglied aufweisen kann und/oder eine Doppelbindung enthalten kann;

5

R^{30} auch für einen Rest der Formel $A-CO-OR^{21}$ oder $-CO-NR^{23}R^{23b}$ stehen kann, worin A für C_1 - C_4 -Alkylen steht;

10

R^{31} auch für eine Gruppe der Formeln $NR^{22}R^{23}$, $N=CR^{29}R^{30}$ oder $N=C(R^{25})NR^{22}R^{23}$ stehen kann;

wobei die aliphatischen und/oder alicyclischen Gruppen der Restdefinitionen von R^{21} - R^{36} ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten R^w tragen können:

15

R^w Halogen, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkinyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy oder C_3 - C_6 -Cycloalkenyloxy; oder

20

R^2 für einen cyclischen Rest steht, der unter C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, Phenyl, 5-, 6- oder 7-gliedrigen aromatischen Heterocyclen und C-gebundenen, 5-, 6- oder 7-gliedrigen gesättigten oder partiell ungesättigten Heterocyclen, wobei die gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclen 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N und S aufweisen und 1 oder 2 Carbonylgruppen als Ringlieder enthalten können, ausgewählt ist, wobei die alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^2 teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L^{R^2} aufweisen können:

25

30

L^{R^2} Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), Nitro, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkinyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_2 - C_{10} -Alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkylcarbonyl, NR^5R^6 , $NR^5-C(=O)-R^6$, $NR^5-C(=S)-R^6$, $S(=O)_nB^1$, $C(=O)B^2$, $C(=S)B^2$, eine Gruppe $-C(=N-OR^7)B^3$, eine Gruppe $-C(=N-NR^8R^9)B^4$, Phenyl oder ein 5-, 6-, 7-, 8-, 9- oder 10-gliedriger gesättigter, teilweise ungesättigter oder aromatischer Heterocyclen, der 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S als Ringglieder aufweist, und worin Phenyl und der Heterocyclen unsubstituiert sind oder 1, 2, 3 oder 4 glei-

35

40

che oder verschiedene Substituenten aufweisen können, die unter Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₂-Alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, Amino, C₁-C₄-Alkyl-amino und Di-(C₁-C₄-Alkyl)-amino ausgewählt sind; worin

5

R⁵, R⁶ unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl und C₃-C₆-Cycloalkenyl, wobei die 5 letztgenannten Reste 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten, ausgewählt unter Cyano, C₁-C₄-Alkoximino, C₂-C₄-Alkenyloximino, C₂-C₄-Alkynyloximino und C₁-C₄-Alkoxy, aufweisen können;

10

B¹ für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl, Amino, C₁-C₈-Alkyl-amino oder Di-(C₁-C₈-alkyl)amino steht;

15

n für 0, 1 oder 2 steht;

B² für C₂-C₈-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkynyloxy oder einen der bei B¹ genannten Reste steht;

20

B³ und B⁴ unabhängig voneinander für C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkynyloxy oder einen Rest NR¹⁰R¹¹ stehen;

25

R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkynyl, wobei die vier letztgenannten Reste 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 gleiche oder verschiedene Substituenten R^a aufweisen können; oder R⁸ und R⁹ und/oder R¹⁰ und R¹¹ bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-, 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder teilweise ungesättigten Ring, der 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten R^b aufweisen kann; wobei

30

35

R^a, R^b unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy stehen;

und wobei die aliphatischen, alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L^{R2} ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können;

40

- 5 R^3 für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl oder C_2 - C_8 -Alkynyl, wobei die drei letztgenannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 Substituenten, ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C_1 - C_2 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino und Di- $(C_1$ - C_4 -Alkyl)-amino, aufweisen können;
- 10 Het für einen C- oder N-gebundenen, 5- oder 6-gliedrigen aromatischen Heterocyclus steht, der 1, 2, 3 oder 4 unter N, O und S ausgewählte Heteroatome als Ringglieder aufweist und der teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweisen kann:
- 15 L Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), Nitro, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkynyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_2 - C_{10} -Alkynylcarbonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkylcarbonyl, $NR^{55}R^{66}$, $NR^{55a}-C(=O)-R^{66a}$, $NR^{55a}-C(=S)-R^{66a}$, $S(=O)_2C^1$, $C(=O)C^2$, $C(=S)C^2$, eine Gruppe $-C(=N-OR^{77})C^3$, eine Gruppe $-C(=N-NR^{88}R^{99})C^4$, Phenyl oder ein 5-, 6-, 7-, 8-, 9- oder 10-gliedriger gesättigter, teilweise un-
- 20 gesättigter oder aromatischer Heterocyclus, der 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglieder aufweist, und worin Phenyl und der Heterocyclus unsubstituiert sind oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten aufweisen können, die unter Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C_1 - C_2 -Alkyl, C_1 - C_2 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl, C_1 - C_4 -Alkylcarbonyl, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino und Di- $(C_1$ - C_4 -Alkyl)amino ausgewählt sind, worin
- 25 R^{55} , R^{66} , R^{55a} , R^{66a} unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl und C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^{55} und/oder R^{66} teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2, 3 oder 4 Cyanosubstituenten aufweisen können; und wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von R^{55a} und/oder R^{66a}
- 30 sowie die alicyclischen Restdefinitionen von R^{55} , R^{66} , R^{55a} und/oder R^{66a} teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten, ausgewählt unter Cyano, C_1 - C_4 -Alkoximino, C_2 - C_4 -Alkenyloximino, C_2 - C_4 -Alkynyloximino und C_1 - C_4 -Alkoxy, aufweisen können;
- 40

- C^1 für Wasserstoff, Hydroxy, C_1 - C_8 -Alkyl, Amino, C_1 - C_8 -Alkylamino oder Di-(C_1 - C_8 -alkyl)-amino steht;
- r für 0, 1 oder 2 steht;
- C^2 für C_2 - C_8 -Alkenyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy oder einen der bei C^1 genannten Reste steht;
- C^3 und C^4 unabhängig voneinander für C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy oder einen Rest $NR^{10a}R^{11a}$ stehen;
- R^{77} , R^{88} , R^{99} , R^{10a} , R^{11a} unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl und C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die vier letztgenannten Reste 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 gleiche oder verschiedene Substituenten R^{aa} aufweisen können; oder R^{88} und R^{99} und/oder R^{10a} und R^{11a} zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bilden einen 4-, 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder teilweise ungesättigten Ring, der 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten R^{bb} aufweisen kann; wobei
- R^{aa} , R^{bb} unabhängig voneinander für Halogen, Hydroxy, C_1 - C_8 -Alkyl oder C_1 - C_8 -Alkoxy stehen;
- und wobei die aliphatischen, alicyclischen, heterocyclischen und aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits teilweise oder vollständig halogeniert sein können,
- und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.
2. 5-Hetarylpyrimidine nach Anspruch 1, wobei R^2 für einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen heterocyclischen Rest steht.
3. 5-Hetarylpyrimidine nach Anspruch 2, wobei R^2 ausgewählt ist unter Pyrrolyl, Pyrazoly, Imidazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1,2,4-Triazolyl, Tetrazoly, Oxazolyl, Isoxazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, Furyl, Thienyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, 1,2,3-Triazinyl, 1,2,4-Triazinyl und 1,3,5-Triazinyl, wobei R^2 durch C oder N an das Pyrimidinskelett der Formel I gebunden ist, und wobei der heteroaromatische

Rest R² teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L^{R2} aufweisen kann.

4. 5-Hetarylpyrimidine nach Anspruch 3, wobei R² ausgewählt ist unter Pyrazol-1-yl,
5 3-Aminopyrazol-1-yl, [1,2,4]Triazol-1-yl, 3-Cyano-[1,2,4]triazol-1-yl, [1,2,3]Triazol-1-yl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl, Pyridin-2-yl, (6-Methyl)-pyridin-2-yl, Pyrimidin-2-yl, Pyrazin-2-yl, Pyridazin-3-yl, [1,3]Thiazol-2-yl, (4,5-Dimethyl)-[1,3]thiazol-2-yl, 7-Aminoindazol-1-yl, Pyrazol-3-on-1-yl, 2-Hydroxyimidazol-1-yl, 3-Hydroxypyrazolin-1-yl und 5-Hydroxy-1,2,4-triazol-1-yl,
10 wobei der heterocyclische Rest R² teilweise oder vollständig halogeniert sein kann.
5. 5-Hetarylpyrimidine nach Anspruch 1, wobei R² ausgewählt ist unter Halogen, N₃, CN, C(=Z)OR²¹, C(=Z)NR²²R²³, C(=Z)NR²⁴-NR²²R²³, C(=Z)R²⁵, ON(=CR²⁹R³⁰),
15 O-C(=Z)R²⁵, NR²²R^{23a}, NR³¹(C(=Z)R²⁵), NR³¹(C(=Z)OR²¹), NR³¹(C(=Z)-NR²²R²³), NR³²(N=CR²⁹R²⁰), NR³²NR²²R²³, NR³²OR²¹ und C(=N-Z' -R²⁵)SR²¹.
6. 5-Hetarylpyrimidine nach Anspruch 5, wobei R² ausgewählt ist unter CN, C(=O)OR²¹, C(=O)NR²²R²³, C(=NOR³⁴)NR²²R²³, C(=O)NR²⁴-NR²²R²³, C(=O)R²⁵,
20 C(=S)R²⁵, C(=NR³³)R²⁵, C(=NOR³⁴)R²⁵, C(=N-NR³⁵R³⁶)R²⁵, ON(=CR²⁹R³⁰), NR³¹(C(=O)R²⁵), NR³¹(C(=O)OR²¹), NR³¹(C(=O)-NR²²R²³), NR³²(N=CR²⁹R³⁰), NR³²OR²¹, C(=N-OR²⁵)SR²¹ und C(=N-R²⁵)SR²¹.
7. 5-Hetarylpyrimidine nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R¹ für
25 C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl steht, oder für C₃-C₆-Cycloalkyl steht, welches 1, 2, 3 oder 4 gleiche oder verschiedene Substituenten, ausgewählt unter Halogen und C₁-C₄-Alkyl, aufweisen kann.
8. 5-Hetarylpyrimidine nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R³ für
30 Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht.
9. 5-Hetarylpyrimidine nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin Het für einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest steht, der wenigstens ein Stickstoffatom und gegebenenfalls 1 oder 2 unter O, S und N ausgewählte weitere Heteroatome als Ringglieder aufweist, und der 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist.
35
10. 5-Hetarylpyrimidine nach Anspruch 9, worin Het ausgewählt ist unter Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1,2,4-Triazolyl, Oxazolyl, Thiazolyl, Isoxazo-

lyl, Isothiazolyl, Pyridinyl und Pyrimidinyl, das jeweils 1, 2 oder 3 gleiche oder verschiedene Substituenten L aufweist.

- 5 11. 5-Hetarylpyrimidine nach Anspruch 9 oder 10, worin der heteroaromatische Rest Het 6-gliedrig ist und wenigstens einen Substituenten L in der ortho- oder para-Position bezüglich der Bindungsstelle zum Pyrimidinskelett der Formel I aufweist.
- 10 12. 5-Hetarylpyrimidine nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin die Substituenten L unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Halogen, Cyano, Nitro, NH₂, C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)-amino, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, NH-C(O)-C₁-C₆-Alkyl, einem Rest C(S)C² und einem Rest C(O)C², worin C² die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen aufweist.
- 15 13. Verwendung von 5-Hetarylpyrimidinen der allgemeinen Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und/oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen.
- 20 14. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge wenigstens eines 5-Hetarylpyrimidins der allgemeinen Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und/oder einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I behandelt.
- 25 15. Verwendung von 5-Hetarylpyrimidinen der allgemeinen Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und/oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I zur Bekämpfung von arthropoden Pflanzenschädlingen.
- 30 16. Verfahren zur Bekämpfung von arthropoden Pflanzenschädlingen und/oder Nematoden, bei dem man die arthropoden Pflanzenschädlinge und/oder Nematoden oder die vor Befall mit diesen Schadorganismen zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Boden mit einer wirksamen Menge wenigstens eines 5-Hetarylpyrimidins der Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und/oder einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I behandelt.
- 35 17. Mittel, enthaltend wenigstens ein 5-Hetarylpyrimidin der allgemeinen Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz von I und wenigstens einen festen oder flüssigen Trägerstoff.

18. Saatgut, enthaltend wenigstens ein 5-Hetarylpyrimidin der Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz von I.
- 5 19. Verwendung von 5-Hetarylpyrimidinen der allgemeinen Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und ihrer pharmazeutisch geeigneten Salze zur Herstellung eines Medikaments.
- 10 20. Verwendung nach Anspruch 19 zur Herstellung eines Medikaments zur Behandlung von Krebserkrankungen.
- 15 21. Pharmazeutische Zusammensetzung, enthaltend wenigstens ein 5-Hetarylpyrimidin der allgemeinen Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und/oder ein pharmazeutisch geeignetes Salz davon und einen pharmazeutisch verträglichen Träger.
- 20 22. Verfahren zur Behandlung von Krebserkrankungen bei Säugern, bei dem man dem Säuger, der dies benötigt, eine wirksame Menge eines 5-Hetarylpyrimidins der allgemeinen Formel I, wie in einem der Ansprüche 1 bis 12 definiert, und/oder eines pharmazeutisch geeigneten Salzes davon verabreicht.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2008/057193

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 INV. C07D403/04 A01N43/54 A61K31/506 A61P35/00

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
 C07D A01N A61K A61P

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)

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2007/070606 A (DU PONT [US]; PATEL KANU MAGANBHAI [US]) 21 June 2007 (2007-06-21) Verbindungen aus Table 3 claims 1-21	1-18
Y	WO 2004/087678 A (BASF AG [DE]; TORMO I BLASCO JORDI [DE]; BLETNER CARSTEN [DE]; MUELLE) 14 October 2004 (2004-10-14) cited in the application claims 1-8	1-18
Y	WO 2005/070899 A (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; GEBAUER OLAF [DE]; GAYER HERBERT [DE]; HEIN) 4 August 2005 (2005-08-04) cited in the application claims 1-17	1-18
	-/--	

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier 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.

Z document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search.

17 September 2008

Date of mailing of the international search report

08/10/2008

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

Stroeter, Thomas

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2008/057193

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 1 749 827 A (KYOWA HAKKO KOGYO KK [JP]) 7 February 2007 (2007-02-07) abstract; examples	1-18
A	WO 2005/030216 A (WYETH CORP [US]; ZHANG NAN [US]; AYRAL-KALoustIAN SEMIRAMIS [US]; NGUY) 7 April 2005 (2005-04-07) cited in the application claim 67	1-12, 19-22
X	WO 85/00604 A (STERLING DRUG INC [US]) 14 February 1985 (1985-02-14) examples B-5, B-6	1-12
X	YOUSSEF M S K: "SYNTHESIS OF 1-(2,4-DINITROPHENYL)-3-METHYL-4-(SUBSTITU TED HETEROCYCLES)-2-PYRAZOLIN-5-ONE" ZEITSCHRIFT FUER NATURFORSCHUNG. TEIL B, ANORGANISCHE CHEMIE, ORGANISCHE CHEMIE, VERLAG DER ZEITSCHRIFT FUER NATURFORSCHUNG, TUEBINGEN, DE, vol. 39B, no. 1, 1 January 1984 (1984-01-01), pages 86-89, XP009041665 ISSN: 0340-5087 compounds 13A, B	1-12
X	FISCHER G W: "TETRAZOLE COMPOUNDS. 8 not 1 3/4 . SYNTHESIS OF TETRAZOLYLPYRIMIDINES FROM TETRAZOLYL-SUBSTITUTED ENAMINO KETONES" JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY, HETEROCORPORATION. PROVO, US, vol. 30, no. 6, 1 December 1993 (1993-12-01), pages 1517-1519, XP000882466 ISSN: 0022-152X compounds 3, 5	1-12
X	RUFER, CLEMENS ET AL: "Chemotherapeutic nitroheterocycles. XIX. Synthesis of 5-nitroimidazoles substituted at position 2 by heterocycles" JUSTUS LIEBIGS ANNALEN DER CHEMIE , (7-8), 1465-77 CODEN: JLACBF; ISSN: 0075-4617, 1975, XP009105816 compounds 23 C, D	1-12

-/--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2008/057193

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>KONDO Y ET AL: "STUDIES ON PYRIMIDINE DERIVATIVES XLI. PALLADIUM-CATALYZED CROSS-COUPPLING REACTION OF HALOPYRIMIDINES WITH ARYL- AND VINYLTRIBUTYLSTANNANES" CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN, PHARMACEUTICAL SOCIETY OF JAPAN, TOKYO, vol. 37, no: 10, 1 January 1989 (1989-01-01), pages 2814-2816, XP002933782 ISSN: 0009-2363 compounds 8B, 13B</p>	1-12
X	<p>EIDEN, FRITZ ET AL: "Studies on pyrone derivatives. Part 80. Pyridone, pyrazole and pyrimidine derivatives from 3,5-diacyl-4-pyrones" ARCHIV DER PHARMAZIE (WEINHEIM, GERMANY), 312(10), 863-72 CODEN: ARPMAS; ISSN: 0365-6233, 1979, XP009105783 compound 27</p>	1-12
X	<p>MIKHALEVA, M. A. ET AL: "Pyrimidines. 69. Syntheses from acetylpyrimidines. Bipyrimidines and pyrimidine analogs of chalcone" KHIMIYA GETEROTSIKLICHESKIKH SOEDINENII, (5), 678-83 CODEN: KGSSAQ; ISSN: 0453-8234, 1979, XP009105788 compounds II, V</p>	1-12
X	<p>DD 294 255 A5 (AKAD WISSENSCHAFTEN DDR [DE]) 26 September 1991 (1991-09-26) pages 4,5; examples 6-8</p>	1-12
X	<p>DE 24 12 657 A1 (SCHERING AG) 25 September 1975 (1975-09-25) claims 1,17-19; examples 16-18</p>	1-12
P,Y	<p>WO 2007/110418 A (BASF AG [DE]; RHEINHEIMER JOACHIM [DE]; GROTE THOMAS [DE]; MUELLER BER) 4 October 2007 (2007-10-04) cited in the application the whole document</p>	1-22
P,Y	<p>WO 2007/113322 A (BASF AG [DE]; RHEINHEIMER JOACHIM [DE]; GROTE THOMAS [DE]; MUELLER BER) 11 October 2007 (2007-10-11) cited in the application the whole document</p>	1-22

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2008/057193

Patent document cited in search report	A	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2007070606	A	21-06-2007	AU 2006326449 A1 EP 1965645 A2	21-06-2007 10-09-2008
WO 2004087678	A	14-10-2004	BR PI0409159 A CN 1768045 A EP 1613605 A1 JP 2006522045 T US 2006229328 A1	02-05-2006 03-05-2006 11-01-2006 28-09-2006 12-10-2006
WO 2005070899	A	04-08-2005	BR PI0507063 A DE 102004003493 A1 EP 1711474 A1 JP 2007522120 T US 2005182073 A1	19-06-2007 11-08-2005 18-10-2006 09-08-2007 18-08-2005
EP 1749827	A	07-02-2007	WO 2005095382 A1	13-10-2005
WO 2005030216	A	07-04-2005	AU 2004275733 A1 BR PI0414736 A CA 2539235 A1 CN 1871009 A EP 1663241 A1 JP 2007506746 T KR 20060089215 A MX PA06003207 A	07-04-2005 21-11-2006 07-04-2005 29-11-2006 07-06-2006 22-03-2007 08-08-2006 23-06-2006
WO 8500604	A	14-02-1985	AU 561765 B2 AU 3153084 A DK 127385 A EP 0150206 A1 FI 851112 A IL 72307 A IT 1176419 B JP 60501952 T NO 851066 A NZ 208818 A PH 20211 A US 4512993 A ZA 8405263 A	14-05-1987 04-03-1985 21-03-1985 07-08-1985 20-03-1985 20-12-1987 18-08-1987 14-11-1985 18-03-1985 12-02-1988 20-10-1986 23-04-1985 27-02-1985
DD 294255	A5	26-09-1991	NONE	
DE 2412657	A1	25-09-1975	DK 74375 A JP 50129560 A NL 7503109 A	15-09-1975 13-10-1975 16-09-1975
WO 2007110418	A	04-10-2007	AR 060140 A1	28-05-2008
WO 2007113322	A	11-10-2007	NONE	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2008/057193

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
INV. C07D403/04 A01N43/54 A61K31/506 A61P35/00

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
C07D A01N A61K A61P

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

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

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 2007/070606 A (DU PONT [US]; PATEL KANU MAGANBHAI [US]) 21. Juni 2007 (2007-06-21) Verbindungen aus Table 3 Ansprüche 1-21	1-18
Y	WO 2004/087678 A (BASF AG [DE]; TORMO I BLASCO JORDI [DE]; BLETNER CARSTEN [DE]; MUELLE) 14. Oktober 2004 (2004-10-14) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1-8	1-18
Y	WO 2005/070899 A (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; GEBAUER OLAF [DE]; GAYER HERBERT [DE]; HEIN) 4. August 2005 (2005-08-04) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1-17	1-18
	-/--	

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen Siehe Anhang Patentfamilie

- | | |
|---|--|
| <ul style="list-style-type: none"> * 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 | <ul style="list-style-type: none"> *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist |
|---|--|

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
17. September 2008	08/10/2008

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 Stroeter, Thomas
---	---

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2008/057193

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 1 749 827 A (KYOWA HAKKO KOGYO KK [JP]) 7. Februar 2007 (2007-02-07) Zusammenfassung; Beispiele	1-18
A	WO 2005/030216 A (WYETH CORP [US]; ZHANG NAN [US]; AYRAL-KALOUSTIAN SEMIRAMIS [US]; NGUY) 7. April 2005 (2005-04-07) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 67	1-12, 19-22
X	WO 85/00604 A (STERLING DRUG INC [US]) 14. Februar 1985 (1985-02-14) Beispiele B-5, B-6	1-12
X	YOUSSEF M S K: "SYNTHESIS OF 1-(2,4-DINITROPHENYL)-3-METHYL-4-(SUBSTITU TED HETEROCYCLES)-2-PYRAZOLIN-5-ONE" ZEITSCHRIFT FUER NATURFORSCHUNG. TEIL B, ANORGANISCHE CHEMIE, ORGANISCHE CHEMIE, VERLAG DER ZEITSCHRIFT FUER NATURFORSCHUNG, TUEBINGEN, DE, Bd. 39B, Nr. 1, 1. Januar 1984 (1984-01-01), Seiten 86-89, XP009041665 ISSN: 0340-5087 Verbindungen 13A, B	1-12
X	FISCHER G W: "TETRAZOLE COMPOUNDS. 8 not 1 3/4 . SYNTHESIS OF TETRAZOLYLPYRIMIDINES FROM TETRAZOLYL-SUBSTITUTED ENAMINO KETONES" JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY, HETEROCORPORATION. PROVO, US, Bd. 30, Nr. 6, 1. Dezember 1993 (1993-12-01), Seiten 1517-1519, XP000882466 ISSN: 0022-152X Verbindungen 3, 5	1-12
X	RUFER, CLEMENS ET AL: "Chemotherapeutic nitroheterocycles. XIX. Synthesis of 5-nitroimidazoles substituted at position 2 by heterocycles" JUSTUS LIEBIGS ANNALEN DER CHEMIE , (7-8), 1465-77 CODEN: JLACBF; ISSN: 0075-4617, 1975, XP009105816 Verbindungen 23 C, D	1-12
-/--		

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2008/057193

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	KONDO Y ET AL: "STUDIES ON PYRIMIDINE DERIVATIVES XLI. PALLADIUM-CATALYZED CROSS-COUPPLING REACTION OF HALOPYRIMIDINES WITH ARYL- AND VINYLTRIBUTYLSTANNANES" CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN, PHARMACEUTICAL SOCIETY OF JAPAN, TOKYO, Bd. 37, Nr. 10, 1. Januar 1989 (1989-01-01), Seiten 2814-2816, XP002933782 ISSN: 0009-2363 Verbindungen 8B, 13B	1-12
X	EIDEN, FRITZ ET AL: "Studies on pyrone derivatives. Part 80. Pyridone, pyrazole and pyrimidine derivatives from 3,5-diacyl-4-pyrones" ARCHIV DER PHARMAZIE (WEINHEIM, GERMANY), 312(10), 863-72 CODEN: ARPMAS; ISSN: 0365-6233, 1979, XP009105783 Verbindung 27	1-12
X	MIKHALEVA, M. A. ET AL: "Pyrimidines. 69. Syntheses from acetylpyrimidines. Bipyrimidines and pyrimidine analogs of chalcone" KHIMIYA GETEROTSIKLICHESKIKH SOEDINENII, (5), 678-83 CODEN: KGSSAQ; ISSN: 0453-8234, 1979, XP009105788 Verbindungen II, V	1-12
X	DD 294 255 A5 (AKAD WISSENSCHAFTEN DDR [DE]) 26. September 1991 (1991-09-26) Seiten 4,5; Beispiele 6-8	1-12
X	DE 24 12 657 A1 (SCHERING AG) 25. September 1975 (1975-09-25) Ansprüche 1,17-19; Beispiele 16-18	1-12
P,Y	WO 2007/110418 A (BASF AG [DE]; RHEINHEIMER JOACHIM [DE]; GROTE THOMAS [DE]; MUELLER BER) 4. Oktober 2007 (2007-10-04) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-22
P,Y	WO 2007/113322 A (BASF AG [DE]; RHEINHEIMER JOACHIM [DE]; GROTE THOMAS [DE]; MUELLER BER) 11. Oktober 2007 (2007-10-11) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-22

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2008/057193

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2007070606	A	21-06-2007	AU 2006326449 A1 EP 1965645 A2	21-06-2007 10-09-2008
WO 2004087678	A	14-10-2004	BR PI0409159 A CN 1768045 A EP 1613605 A1 JP 2006522045 T US 2006229328 A1	02-05-2006 03-05-2006 11-01-2006 28-09-2006 12-10-2006
WO 2005070899	A	04-08-2005	BR PI0507063 A DE 102004003493 A1 EP 1711474 A1 JP 2007522120 T US 2005182073 A1	19-06-2007 11-08-2005 18-10-2006 09-08-2007 18-08-2005
EP 1749827	A	07-02-2007	WO 2005095382 A1	13-10-2005
WO 2005030216	A	07-04-2005	AU 2004275733 A1 BR PI0414736 A CA 2539235 A1 CN 1871009 A EP 1663241 A1 JP 2007506746 T KR 20060089215 A MX PA06003207 A	07-04-2005 21-11-2006 07-04-2005 29-11-2006 07-06-2006 22-03-2007 08-08-2006 23-06-2006
WO 8500604	A	14-02-1985	AU 561765 B2 AU 3153084 A DK 127385 A EP 0150206 A1 FI 851112 A IL 72307 A IT 1176419 B JP 60501952 T NO 851066 A NZ 208818 A PH 20211 A US 4512993 A ZA 8405263 A	14-05-1987 04-03-1985 21-03-1985 07-08-1985 20-03-1985 20-12-1987 18-08-1987 14-11-1985 18-03-1985 12-02-1988 20-10-1986 23-04-1985 27-02-1985
DD 294255	A5	26-09-1991	KEINE	
DE 2412657	A1	25-09-1975	DK 74375 A JP 50129560 A NL 7503109 A	15-09-1975 13-10-1975 16-09-1975
WO 2007110418	A	04-10-2007	AR 060140 A1	28-05-2008
WO 2007113322	A	11-10-2007	KEINE	