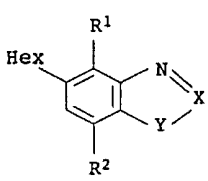




<p>(51) Internationale Patentklassifikation ⁷ : C07D 249/18, 271/12, 285/14, 263/54, 277/62, 235/04, A01N 43/647, 43/78, 43/828, 43/76</p>	A1	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/68210</p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 16. November 2000 (16.11.00)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/04042</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 5. Mai 2000 (05.05.00)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: 199 21 201.5 7. Mai 1999 (07.05.99) DE</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AK- TIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(72) Erfinder; und</p> <p>(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MAYER, Guido [DE/DE]; Gutleuthausstrasse 8, D-67433 Neustadt (DE). BAUMANN, Ernst [DE/DE]; Falkenstrasse 6a, D-67373 Dudenhofen (DE). VON DEYN, Wolfgang [DE/DE]; An der Bleiche 24, D-67435 Neustadt (DE). KUDIS, Steffen [DE/DE]; Spelzenstrasse 10, D-68167 Mannheim (DE). LANGE- MANN, Klaus [DE/DE]; Goldbergstr. 18, D-67551 Worms (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Mandelring 74, D-67433 Neustadt (DE). NEIDLEIN, Ulf [DE/DE]; Brahmstr. 3, D-68165 Mannheim (DE). WITSCHHEL, Matthias [DE/DE]; Wittelsbachstr. 81, D-67061 Ludwigshafen (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, D-69123 Heidelberg (DE). VOLK, Thorsten [DE/DE]; Strassburger Ring 16-18,</p>	<p>D-68229 Mannheim (DE). OTTEN, Martina [DE/DE]; Gun- terstr. 28, D-67069 Ludwigshafen (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Zum Pfautenturm 17, D-67346 Speyer (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE).</p> <p>(74) Anwälte: KINZEBACH, Werner usw.; Ludwigsplatz 4, D-67059 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(81) Bestimmungsstaaten: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</p>	
<p>(54) Title: BENZOHETERO CYCLYL CYCLO HEXENONES AND THEIR USE AS HERBICIDES</p>		
<p>(54) Bezeichnung: BENZOHETERO CYCLYL CYCLO HEXENONE UND IHRE VERWENDUNG ALS HERBIZIDE</p>		
<div style="text-align: center;">  <p>(I)</p> </div>		
<p>(57) Abstract</p> <p>The invention relates to cyclohexenone derivatives of benzo-condensed, unsaturated 5-ring nitrogen heterocycles of general formula (I) wherein X represents N or a group C-R³, Y represents O, S, SO, SO₂ or NR⁴ or X-Y represent S=N and X represents sulfur, and the variables R¹, R² and Hex have the meanings given in claim 1. The invention also relates to a method for producing these compounds, to agents containing these compounds, and to their use as herbicides.</p> <p>(57) Zusammenfassung</p> <p>Die vorliegende Erfindung betrifft Cyclohexenon-Derivate benzokondensierter ungesättigter 5-Ring-Stickstoffheterocyclen der allgemeinen Formel (I), worin X für N oder eine Gruppe C-R³ steht; Y für O, S, SO, SO₂ oder NR⁴ steht oder X-Y für S=N stehen, und X Schwefel bedeutet; und die Variablen R¹, R² und Hex die in Anspruch 1 genannte Bedeutung aufweisen. Die vorliegende Erfindung betrifft weiterhin ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, Mittel, die diese Verbindungen enthalten, und ihre Verwendung als Herbizide.</p>		

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

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

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

BENZOHETERO CYCLYL CYCLO HEXENONE UND IHRE VERWENDUNG ALS HERBIZIDE

5 Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft Cyclohexenon-Derivate benzo-
kondensierter, ungesättigter 5-Ring-Stickstoffheterocyclen, Ver-
fahren zur Herstellung derartiger Cyclohexenon-Derivate, Mittel,
10 die derartige Verbindungen enthalten, sowie die Verwendung der
Cyclohexenon-Derivate oder Mittel, die diese enthalten, zur
Schadpflanzenbekämpfung.

Aus der WO 96/05182 sind Saccharin-Derivate mit herbizider Wir-
15 kung bekannt, die am Benzolkern des Saccharingerüstes mit einem
(2-Cyclohexan-1,3-dion)carbonyl-Rest substituiert sind.

Aus der WO 99/03845 sind Cyclohexan-1,3-dione bekannt, die in der
2-Position einen Benzoylrest aufweisen. Der Benzoylrest kann sei-
20 nerseits mit Heteroaromaten substituiert sein. Die Verbindungen
weisen Herbizid-Wirkung auf.

Aus der WO 97/09324 sind Cyclohexan-1,3-dione mit Herbizid-Wir-
kung bekannt, die in der 2-Position einen benzokondensierten
25 Schwefel-Heterocyclus, z.B. einen Thiochroman- oder einen Benzo-
dihydrothiophen-Rest aufweisen, der über eine Carbonylgruppe ge-
bunden ist.

Aus der EP-A 283 261 sind ähnliche Verbindungen bekannt, worin
30 der Cyclohexenonring in der 2-Position mit einem heteroaromati-
schen Rest substituiert ist. Als heteroaromatische Reste werden
Schwefel, Stickstoff und/oder Sauerstoff enthaltende 5-Ring- oder
6-Ring-Heterocyclen genannt.

35 Die herbiziden Eigenschaften der aus den genannten Druckschriften
bekannten Verbindungen sowie deren Verträglichkeiten gegenüber
Kulturpflanzen vermögen jedoch nur bedingt die Anforderungen an
Herbizide zu befriedigen.

40 Der vorliegenden Erfindung liegt somit die Aufgabe zugrunde neue
Verbindungen mit herbizider Wirkung bereitzustellen, die vorzugs-
weise eine höhere Wirksamkeit als die herbiziden Substanzen des
Standes der Technik und/oder eine bessere Selektivität gegenüber
Schadpflanzen aufweisen.

45

2

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass diese Aufgabe durch Cyclohexenon-Derivate benzokondensierter, ungesättigter 5-Ring-Stickstoffheterocyclen der nachstehend definierten, allgemeinen Formel I gelöst wird.

5

Demnach betrifft die vorliegende Erfindung Cyclohexenon-Derivate benzokondensierter, ungesättigter 5-Ring-Stickstoffheterocyclen der allgemeinen Formel I,

10



I

15

worin

20

X für N oder eine Gruppe C-R³ steht;

Y für O, S, SO, SO₂ oder NR⁴ steht

25

oder

X-Y für S=N stehen, und X Schwefel bedeutet;

R¹ Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl,
 C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy,
 C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio,
 C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl,
 C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl,
 Aminosulfonyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,
 C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl,
 C₁-C₆-Alkylsulfinyl-C₁-C₆-alkyl,
 C₁-C₆-Alkylsulfonyl-C₁-C₆-alkyl,
 C₁-C₆-Alkylamino-C₁-C₆-alkyl, oder
 Di-(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₆-alkyl;

40

R² Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;

R³ Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Amino,
 Mercapto, Rhodano, Hydrazid, C₁-C₆-Alkyl,

45

C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Aminoalkyl,
 C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl,

3

C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Hydroxyalkoxy,
C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl,

5 C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino,
C₃-C₆-Cycloalkylamino, wobei die Alkyl- und
Cycloalkylgruppen der drei letztgenannten Reste teilweise
oder vollständig halogeniert und/oder ein bis drei
Substituenten, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkoxy oder Hydroxy
tragen können,

10

C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio,
C₁-C₆-Hydroxyalkylthio, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkylthio,

15

Phenyl, Naphthyl, Heterocyclyl, Phenoxy, Phenylamino,
Diphenylamino, wobei die Phenyl- und Heterocyclylgruppen
der sechs letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder
vollständig halogeniert und/oder einen, zwei oder drei
Substituenten, ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy,
C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy und
20 C₁-C₄-Halogenalkoxy, tragen können,

C(O)OR⁵, oder C(O)N(R⁶)R⁷; und

25

R⁴ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,

30

Phenyl, Naphthyl, wobei die zwei letztgenannten Reste
ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert und/oder
einen, zwei oder drei Substituenten, ausgewählt unter
Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Halogenalkoxy, tragen können;
bedeuten, wobei

35

R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,

40

Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht, wobei die drei
letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig
halogeniert und/oder einen, zwei oder drei Substituenten,
ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl,
C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Halogenalkoxy,
tragen können;

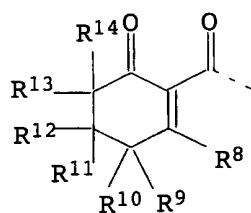
45

R⁶, R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl,
C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl,
C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,

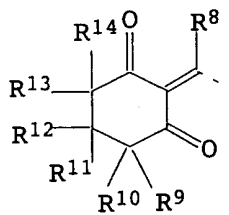
4

Phenyl oder Naphthyl stehen, wobei die zwei
 letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig
 halogeniert und/oder einen, zwei oder drei Substituenten,
 ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl,
 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Halogenalkoxy,
 tragen können; und

Hex für substituiertes (3-Oxo-1-cyclohexen-2-yl)carbonyl
 der Formel IIa oder für substituiertes (1,3-Dioxo-2-cy-
 clohexyl)methylen der Formel IIb steht,



IIa



IIb

steht, wobei die Variablen R⁸ bis R¹⁴ folgende Bedeutung ha-
 ben:

R⁸ Hydroxy, Mercapto, Halogen, OR¹⁵, SR¹⁵, SOR¹⁶,
 SO₂R¹⁶, OSO₂R¹⁶, P(O)R¹⁷R¹⁸, OP(O)R¹⁷R¹⁸,
 P(S)R¹⁷R¹⁸, OP(S)R¹⁷R¹⁸, NR¹⁹R²⁰, ONR¹⁹R²⁰ oder N-
 gebundenes Heterocyclyl, das partiell oder voll-
 ständig halogeniert sein kann und/oder einen bis
 drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro,
 Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
 C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

R⁹, R¹³ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl
 oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;

R¹⁰, R¹², R¹⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff oder
 C₁-C₄-Alkyl;

R¹¹ Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl,
 C₁-C₆-Halogenalkyl, Di-(C₁-C₆-alk-
 oxy)-methyl, (C₁-C₆-Alkoxy)-(C₁-C₆-alkyl-
 thio)-methyl, Di-(C₁-C₆-alkylthio)methyl,
 C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkyl-
 thio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkyl-
 sulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Al-
 kylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl,

5

C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-carbonyl;

5 1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl oder 1,3-Dithian-2-yl, wobei die sechs letztgenannten Reste durch einen bis drei C₁-C₄-Alkylreste substituiert sein können;

10 oder

R¹⁰ und R¹² oder R¹² und R¹⁴ bilden gemeinsam eine π -Bindung oder eine C₁-C₅-Alkylkette, die einen zwei oder drei Reste aus folgender Gruppe tragen kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;

oder

20 R¹⁰ und R¹⁴ bilden gemeinsam eine C₁-C₄-Alkylkette, die einen zwei oder drei Reste aus folgender Gruppe tragen kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;

oder

25 R¹¹ und R¹² bilden gemeinsam eine -O-(CH₂)_p-O-, -O-(CH₂)_p-S-, -S-(CH₂)_p-S-, -O-(CH₂)_q- oder -S-(CH₂)_q-Kette, worin p für 2, 3, 4 oder 5, und q für 2, 3, 4, 5 oder 6 stehen, und die durch einen zwei oder drei Reste aus folgender Gruppe substituiert sein kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;

oder

35 R¹¹ und R¹² bilden gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an dem sie gebunden sind, eine Carbonylgruppe;

wobei

40 R¹⁵ C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkinylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxy-carbonyl, C₃-C₆-Alkinyl-oxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkylthio-carbonyl, C₁-C₆-Alkyl-aminocar-bonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocar-bonyl, C₃-C₆-Alkinylaminocar-bonyl, N,N-Di(C₁-C₆-alkyl)aminocar-bonyl,

45

6

- N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl,
 N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl,
 N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl,
 N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl,
 N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl,
 Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkoxyimi-
 no-C₁-C₆-alkyl, wobei die genannten Alkyl-, Cyclo-
 alkyl- oder Alkoxyreste partiell oder vollständig
 halogeniert sein können und/oder eine, zwei oder drei
 der folgenden Gruppen tragen können: Cyano,
 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino,
 C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alko-
 xy-C₁-C₄-alkoxycarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Al-
 kylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-Alkyl)aminocarbonyl,
 Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy oder
 C₃-C₆-Cycloalkyl;
- Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbo-
 nyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl, Phenoxycarbonyl,
 Phenoxythiocarbonyl, Phenylaminocarbonyl,
 N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-phenylaminocarbonyl, Phe-
 nyl-C₂-C₆-alkenylcarbonyl, Heterocyclyl, Heterocy-
 clyl-C₁-C₆-alkyl, Heterocyclylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 Heterocyclylcarbonyl, Heterocyclylloxycarbonyl, Hete-
 rocyclyloxythiocarbonyl, Heterocyclylaminocarbonyl,
 N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-heterocyclylaminocarbonyl oder He-
 terocyclyl-C₁-C₆-alkenylcarbonyl, wobei der Phenyl-
 oder der Heterocyclyl-Rest der 18 letztgenannten
 Substituenten partiell oder vollständig halogeniert
 sein kann und/oder einen bis drei der folgenden Reste
 tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Ha-
 logenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
 bedeutet;
- R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl oder
 C₃-C₆-Cycloalkyl, wobei die vier genannten Reste parti-
 tiell oder vollständig halogeniert sein können und/
 oder eine, zwei oder drei der folgenden Gruppen tra-
 gen können: Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
 C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkyl-
 carbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl oder C₁-C₄-Halogenalk-
 oxycarbonyl,
- Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Heterocyclyl oder Hetero-
 cyclyl-C₁-C₄-alkyl, wobei der Phenyl- oder der Hete-
 rocyclylrest der vier letztgenannten Substituenten
 partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/

7

oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl; bedeutet;

5

R¹⁷, R¹⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenoxy, wobei die drei letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl; bedeuten;

10

15

R¹⁹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)amino oder C₁-C₆-Alkylcarbonylamino, wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- oder Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen können: Cyano, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino-carbonyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl,

20

25

30

Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylcarbonyl, Heterocyclyl, Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl oder Heterocyclylcarbonyl, wobei der Phenyl- oder Heterocyclyl-Rest der sechs letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen bis drei der folgenden Reste tragen kann:

35

Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; bedeutet;

40

R²⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl; bedeutet

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die Cyclohexanon-Derivate der Formel I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel

45

und Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Cyclohexanon-Derivaten der Formel I gefunden.

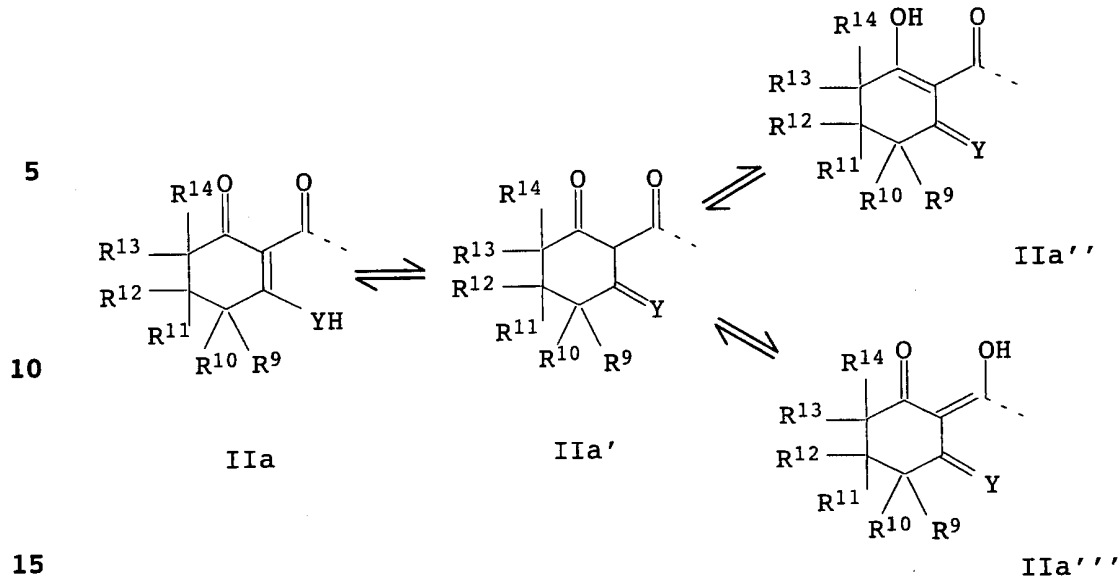
Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster
5 ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als Enantiomeren oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren als auch deren Gemische.

10 Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des Salzes in der Regel nicht ankommt. Im Allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die
15 herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

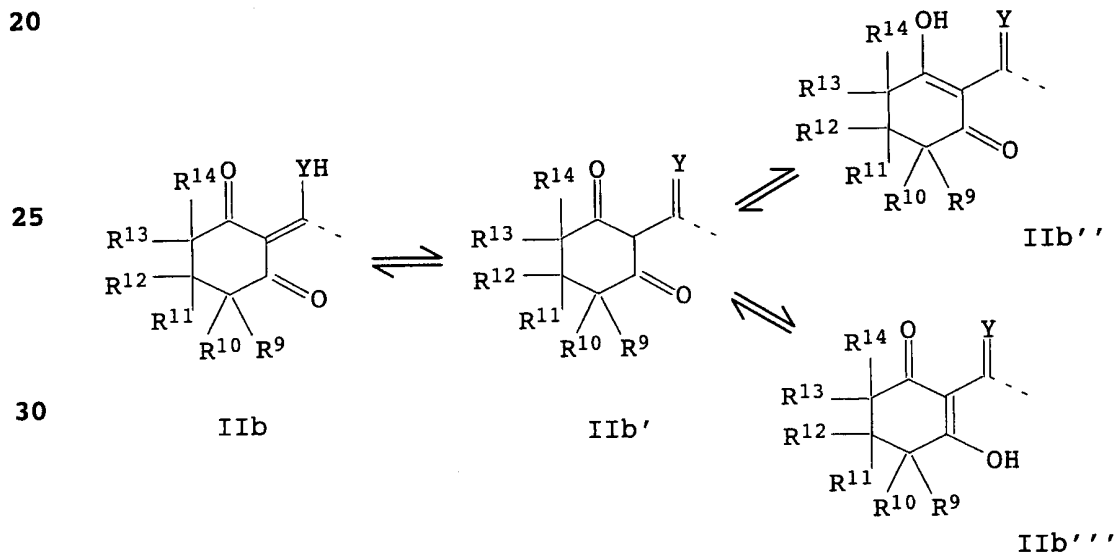
Es kommen als Kationen insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle,
20 vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C_1-C_4 -Alkyl, Hydroxy- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, Hydroxy- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein
25 können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise
30 Tri(C_1-C_4 -alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C_1-C_4 -alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat,
35 Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C_1-C_4 -Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

40 Im Falle von $R^8 = \text{Hydroxy oder Mercapto } \{Z = O, S\}$ steht IIa auch stellvertretend für die tautomeren Formen IIa', IIa'' und IIa'''.



beziehungsweise IIb auch stellvertretend für die tautomeren Formen IIb', IIb'' und IIb'''.



35

Die für die Substituenten R¹ bis R²⁰ oder als Reste an Phenyl- und Heterocycl-
 Resten genannten organischen Molekülteile stellen
 Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen
 Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also
 40 alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylthio-,
 Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-, Halogenalkylsulfinyl-,
 Alkylsulfonyl-, Halogenalkylsulfonyl-, N-Alkylamino-,
 N,N-Dialkylamino-, N-Halogenalkylamino-, N-Alkoxyamino-,
 N-Alkoxy-N-alkylamino-, N-Alkylcarbonylamino-, Alkylcarbonyl-,
 45 Halogenalkylcarbonyl-, Alkoxycarbonyl-, Halogenalkoxycarbonyl-,
 Alkylthiocarbonyl-, Alkylcarbonyloxy-, Alkylaminocarbonyl-,
 Dialkylaminocarbonyl-, Dialkylaminothiocarbonyl-, Alkoxyalkyl-,

10

- Alkoxyiminoalkyl-, Phenylalkylcarbonyl,
 Heterocyclalkylcarbonyl, Phenylalkenylcarbonyl-,
 Heterocyclalkenylcarbonyl-, N-Alkoxy-N-alkylaminocarbonyl-,
 N-Alkyl-N-phenylaminocarbonyl-,
 5 N-Alkyl-N-heterocyclaminocarbonyl-, Phenylalkyl-,
 Heterocyclalkyl-, Phenylcarbonylalkyl-,
 Heterocyclcarbonylalkyl-, Alkoxyalkoxycarbonyl-,
 Alkenylcarbonyl-, Alkenyloxycarbonyl-, Alkenylaminocarbonyl-,
 N-Alkenyl-N-alkylaminocarbonyl-,
 10 N-Alkenyl-N-alkoxyaminocarbonyl-, Alkinylcarbonyl-,
 Alkinyloxycarbonyl-, Alkinylaminocarbonyl-,
 N-Alkinyl-N-alkylaminocarbonyl-,
 N-Alkinyl-N-alkoxyaminocarbonyl-, Alkenyl-, Alkinyl-,
 Halogenalkenyl-, Halogenalkinyl-, Alkenyloxy-, Alkinyloxy,
 15 Alkandiyl-, Alkendiyl-, Alkadiendiyl- oder Alkindiyl-Teile können
 geradkettig oder verzweigt sein. Sofern nicht anders angegeben
 tragen halogenierte Substituenten vorzugsweise ein bis fünf
 gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen
 steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

20

Ferner bedeuten beispielsweise:

- C₁-C₄-Alkyl: z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl,
 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl oder 1,1-Dimethylethyl;

25

- C₁-C₆-Alkyl, sowie die Alkylteile von C₁-C₆-Alkylamino,
 Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)amino,
 N(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl,
 N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl,
 30 (C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl,
 N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-phenylaminocarbonyl,
 N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-heterocyclaminocarbonyl: C₁-C₄-Alkyl, wie
 voranstehend genannt, sowie z.B. 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,
 40 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl oder
 1-Ethyl-3-methylpropyl;

35

40

- C₁-C₄-Halogenalkyl: einen C₁-C₄-Alkylrest, wie vorstehend
 genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
 45 Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl,
 Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl,
 Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl,

11

- Chlordifluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl,
 2-Iodethyl, 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,
 5 Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl,
 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl,
 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl,
 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl,
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl,
 10 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl,
 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl,
 4-Brombutyl oder Nonafluorbutyl;
- C₁-C₆-Halogenalkyl, sowie die Halogenalkylteile von
 15 N-C₁-C₆-Halogenalkylamino: C₁-C₄-Halogenalkyl, wie
 voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentyl,
 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl,
 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl oder
 Dodecafluorhexyl;
- 20 – C₁-C₄-Alkoxy: z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy,
 Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy oder
 1,1-Dimethylethoxy;
- 25 – C₁-C₆-Alkoxy, sowie die Alkoxyteile von N-C₁-C₆-Alkoxyamino,
 N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)amino,
 C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl,
 N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl,
 N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl und
 30 N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl:
 C₁-C₄-Alkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentoxy,
 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy,
 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy,
 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy,
 35 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
 40 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- C₁-C₄-Halogenalkoxy: einen C₁-C₄-Alkoxyrest, wie voranstehend
 genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
 Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy,
 45 Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy,
 Bromdifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy,
 2-Brommethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy,

12

- 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy,
 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Di-chlor-2-fluorethoxy,
 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2-Fluorpropoxy,
 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy,
 5 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy,
 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy,
 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy,
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy,
 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy,
 10 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy,
 4-Brombutoxy oder Nonafluorbutoxy;
- C₁-C₆-Halogenalkoxy: C₁-C₄-Halogenalkoxy, wie voranstehend
 genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy,
 15 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy,
 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy oder
 Dodecafluorhexoxy;
- C₁-C₄-Alkylthio (C₁-C₄-Alkylsulfanyl: C₁-C₄-Alkyl-S-): z.B.
 20 Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio,
 Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio oder
 1,1-Dimethylethylthio;
- C₁-C₆-Alkylthio, sowie die Alkylthioteile von
 25 C₁-C₆-Alkylthiocarbonyl: C₁-C₄-Alkylthio, wie voranstehend
 genannt, sowie z.B. Pentylthio, 1-Methylbutylthio,
 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Dimethylpropylthio,
 1-Ethylpropylthio, Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio,
 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio,
 30 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio, 4-Methylpentylthio,
 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio,
 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio,
 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio,
 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio,
 35 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethylpropylthio,
 1-Ethyl-1-methylpropylthio oder 1-Ethyl-2-methylpropylthio;
- C₁-C₄-Halogenalkylthio: einen C₁-C₄-Alkylthioest, wie
 voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch
 40 Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.
 Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio,
 Chlordifluormethylthio, Bromdifluormethylthio,
 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio,
 2-Iodethylthio, 2,2-Difluorethylthio,
 45 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio,
 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio,
 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, Pentafluorethylthio,

13

- 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio,
 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio, 3-Brompropylthio,
 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio,
 2,3-Dichlorpropylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio,
 5 3,3,3-Tri-chlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio,
 Heptafluorpropylthio, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylthio,
 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylthio,
 1-(Brommethyl)-2-bromethylthio, 4-Fluorbutylthio,
 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio oder Nonafluorbutylthio;
- 10 - C₁-C₆-Halogenalkylthio: C₁-C₄-Halogenalkylthio, wie vorstehend
 genannt, sowie 5-Fluorpentylthio, 5-Chlorpentylthio,
 5-Brompentylthio, 5-Iodpentylthio, Undecafluorpentylthio,
 6-Fluorhexylthio, 6-Chlorhexylthio, 6-Bromhexylthio,
 15 6-Iodhexylthio oder Dodecafluorhexylthio;
- C₁-C₄-Alkylsulfinyl (C₁-C₄-Alkyl-S(=O)-): z.B. Methylsulfinyl,
 Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl,
 Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl
 20 oder 1,1-Dimethylethylsulfinyl;
- C₁-C₆-Alkylsulfinyl: C₁-C₄-Alkylsulfinyl, wie vorstehend
 genannt, sowie Pentylsulfinyl, 1-Methylbutylsulfinyl,
 2-Methylbutylsulfinyl, 3-Methylbutylsulfinyl,
 25 2,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1-Ethylpropylsulfinyl,
 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,2-Dimethylpropylsulfinyl,
 Hexylsulfinyl, 1-Methylpentylsulfinyl,
 2-Methylpentylsulfinyl, 3-Methylpentylsulfinyl,
 4-Methylpentylsulfinyl, 1,1-Dimethylbutylsulfinyl,
 30 1,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1,3-Dimethylbutylsulfinyl,
 2,2-Dimethylbutylsulfinyl, 2,3-Dimethylbutylsulfinyl,
 3,3-Dimethylbutylsulfinyl, 1-Ethylbutylsulfinyl,
 2-Ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfinyl,
 1,2,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfinyl
 35 oder 1-Ethyl-2-methylpropylsulfinyl;
- C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl: C₁-C₄-Alkylsulfinylrest, wie
 voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch
 Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.
 40 Fluormethylsulfinyl, Difluormethylsulfinyl,
 Trifluormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl,
 Bromdifluormethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl,
 2-Chlorethylsulfinyl, 2-Bromethylsulfinyl,
 2-Iodethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl,
 45 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfinyl,
 2-Chlor-2-fluorethylsulfinyl,
 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfinyl,

14

- 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfinyl, Pentafluorethylsulfinyl,
 2-Fluorpropylsulfinyl, 3-Fluorpropylsulfinyl,
 2-Chlorpropylsulfinyl, 3-Chlorpropylsulfinyl,
 2-Brompropylsulfinyl, 3-Brompropylsulfinyl,
 5 2,2-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Difluorpropylsulfinyl,
 2,3-Dichlorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfinyl,
 3,3,3-Trichlorpropylsulfinyl,
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfinyl, Heptafluorpropylsulfinyl,
 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfinyl,
 10 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfinyl,
 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfinyl, 4-Fluorbutylsulfinyl,
 4-Chlorbutylsulfinyl, 4-Brombutylsulfinyl oder
 Nonafluorbutylsulfinyl;
- 15 - C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl: C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, wie
 vorstehend genannt, sowie 5-Fluorpentylsulfinyl,
 5-Chlorpentylsulfinyl, 5-Brompentylsulfinyl,
 5-Iodpentylsulfinyl, Undecafluorpentylsulfinyl,
 6-Fluorhexylsulfinyl, 6-Chlorhexylsulfinyl,
 20 6-Bromhexylsulfinyl, 6-Iodhexylsulfinyl oder
 Dodecafluorhexylsulfinyl;
- C₁-C₄-Alkylsulfonyl (C₁-C₄-Alkyl-S(=O)₂-) z.B. Methylsulfonyl,
 Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl,
 25 Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl
 oder 1,1-Dimethylethylsulfonyl;
- C₁-C₆-Alkylsulfonyl: C₁-C₄-Alkylsulfonyl, wie vorstehend
 genannt, sowie Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl,
 30 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl,
 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl,
 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl,
 Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl,
 35 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl,
 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl,
 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl,
 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl,
 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl,
 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl,
 40 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl
 oder 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;
- C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl einen C₁-C₄-Alkylsulfonylrest, wie
 voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch
 45 Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.
 Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl,
 Trifluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl,

15

- Bromdifluormethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl,
 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethylsulfonyl,
 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl,
 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl,
 5 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl,
 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl,
 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl,
 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl,
 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl,
 10 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl,
 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl,
 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl,
 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl,
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl,
 15 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl,
 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl,
 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl,
 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl oder
 Nonafluorbutylsulfonyl;
 20
- C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl: C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, wie
 vorstehend genannt, sowie 5-Fluorpentylsulfonyl,
 5-Chlorpentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl,
 5-Iodpentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl,
 25 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl oder
 Dodecafluorhexylsulfonyl;
- C₁-C₆-Alkylamino: Methylamino, Ethylamino, Propylamino,
 1-Methylethylamino, Butylamino, 1-Methylpropylamino,
 30 2-Methylpropylamino, 1,1-Dimethylethylamino, Pentylamino,
 1-Methylbutylamino, 2-Methylbutylamino, 3-Methylbutylamino,
 2,2-Dimethylpropylamino, 1-Ethylpropylamino, Hexylamino,
 1,1-Dimethylpropylamino, 1,2-Dimethylpropylamino,
 1-Methylpentylamino, 2-Methylpentylamino,
 35 3-Methylpentylamino, 4-Methylpentylamino,
 1,1-Dimethylbutylamino, 1,2-Dimethylbutylamino,
 1,3-Dimethylbutylamino, 2,2-Dimethylbutylamino,
 2,3-Dimethylbutylamino, 3,3-Dimethylbutylamino,
 1-Ethylbutylamino, 2-Ethylbutylamino,
 40 1,1,2-Trimethylpropylamino, 1,2,2-Trimethylpropylamino,
 1-Ethyl-1-methylpropylamino oder 1-Ethyl-2-methylpropylamino;
- Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, also z.B. N,N-Dimethylamino,
 N,N-Di-ethylamino, N,N-Dipropylamino,
 45 N,N-Di-(1-methylethyl)amino, N,N-Dibutylamino,
 N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)amino,
 N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)amino, N-Ethyl-N-methylamino,

16

- N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino,
 N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino,
 N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-(1,1-Di-methylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino,
 5 N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino,
 N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino,
 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,
 N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino,
 10 N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino,
 N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino,
 N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino,
 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino,
 15 N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino,
 N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-amino,
 N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,
 20 N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)-amino,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)-amino oder
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;
- Di-(C₁-C₆-alkyl)amino: Di-(C₁-C₄-alkyl)amino wie voranstehend
 25 genannt, sowie N,N-Dipentylamino, N,N-Dihexylamino,
 N-Methyl-N-pentylamino, N-Ethyl-N-pentylamino,
 N-Methyl-N-hexylamino oder N-Ethyl-N-hexylamino;
- C₁-C₄-Alkylcarbonyl: z.B. Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl,
 30 Propylcarbonyl, 1-Methylethylcarbonyl, Butylcarbonyl,
 1-Methylpropylcarbonyl, 2-Methylpropylcarbonyl oder
 1,1-Dimethylethylcarbonyl;
- C₁-C₆-Alkylcarbonyl, sowie die Alkylcarbonylreste von
 35 C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino:
 C₁-C₄-Alkylcarbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B.
 Pentylcarbonyl, 1-Methylbutylcarbonyl, 2-Methylbutylcarbonyl,
 3-Methylbutylcarbonyl, 2,2-Dimethylpropylcarbonyl,
 1-Ethylpropylcarbonyl, Hexylcarbonyl,
 40 1,1-Dimethylpropylcarbonyl, 1,2-Dimethylpropylcarbonyl,
 1-Methylpentylcarbonyl, 2-Methylpentylcarbonyl,
 3-Methylpentylcarbonyl, 4-Methylpentylcarbonyl,
 1,1-Dimethylbutylcarbonyl, 1,2-Dimethylbutylcarbonyl,
 1,3-Dimethylbutylcarbonyl, 2,2-Dimethylbutylcarbonyl,
 45 2,3-Dimethylbutylcarbonyl, 3,3-Dimethylbutylcarbonyl,
 1-Ethylbutylcarbonyl, 2-Ethylbutylcarbonyl,
 1,1,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylcarbonyl,

- 1-Ethyl-1-methylpropylcarbonyl oder
1-Ethyl-2-methylpropylcarbonyl;
- 5 - C₁-C₄-Halogenalkylcarbonyl: einen C₁-C₄-Alkylcarbonylrest, wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chloracetyl, Dichloracetyl, Trichloracetyl, Fluoracetyl, Difluoracetyl, Trifluoracetyl, Chlorfluoracetyl, Dichlor-fluoracetyl, Chlordifluoracetyl,
- 10 2-Fluorethylcarbonyl, 2-Chlorethylcarbonyl, 2-Bromethylcarbonyl, 2-Iodethylcarbonyl, 2,2-Difluorethylcarbonyl, 2,2,2-Trifluorethylcarbonyl, 2-Chlor-2-fluorethylcarbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylcarbonyl,
- 15 2,2-Dichlor-2-fluorethylcarbonyl, 2,2,2-Trichlorethylcarbonyl, Pentafluorethylcarbonyl, 2-Fluorpropylcarbonyl, 3-Fluorpropylcarbonyl, 2,2-Difluorpropylcarbonyl, 2,3-Di-fluorpropylcarbonyl, 2-Chlorpropylcarbonyl, 3-Chlorpropylcarbonyl,
- 20 2,3-Dichlorpropylcarbonyl, 2-Brompropylcarbonyl, 3-Brompropylcarbonyl, 3,3,3-Trifluorpropylcarbonyl, 3,3,3-Trichlorpropylcarbonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylcarbonyl, Heptafluorpropylcarbonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylcarbonyl,
- 25 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylcarbonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylcarbonyl, 4-Fluorbutylcarbonyl, 4-Chlorbutylcarbonyl, 4-Brombutylcarbonyl oder Nonafluorbutylcarbonyl;
- 30 - C₁-C₆-Halogenalkylcarbonyl: einen C₁-C₄-Halogenalkylcarbonylrest wie voranstehend genannt, sowie 5-Fluorpentylcarbonyl, 5-Chlorpentylcarbonyl, 5-Brompentylcarbonyl, Perfluorpentylcarbonyl, 6-Fluorhexylcarbonyl, 6-Chlorhexylcarbonyl,
- 35 6-Bromhexylcarbonyl oder Perfluorhexylcarbonyl;
- C₁-C₄-Alkoxy carbonyl also z.B. Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propoxycarbonyl, 1-Methylethoxycarbonyl, Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxycarbonyl,
- 40 2-Methylpropoxycarbonyl oder 1,1-Dimethylethoxycarbonyl;
- C₁-C₆-Alkoxy carbonyl: C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, wie vorstehend genannt, sowie z.B. Pentoxycarbonyl, 1-Methylbutoxycarbonyl, 2-Methylbutoxycarbonyl, 3-Methylbutoxycarbonyl,
- 45 2,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Ethylpropoxycarbonyl, Hexoxycarbonyl, 1,1-Dimethylpropoxycarbonyl, 1,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Methylpentoxycarbonyl,

18

- 2-Methylpentoxycarbonyl, 3-Methylpentoxycarbonyl,
 4-Methylpentoxycarbonyl, 1,1-Dimethylbutoxycarbonyl,
 1,2-Dimethylbutoxycarbonyl, 1,3-Dimethylbutoxycarbonyl,
 2,2-Dimethylbutoxycarbonyl, 2,3-Dimethylbutoxycarbonyl,
 5 3,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 1-Ethylbutoxycarbonyl,
 2-Ethylbutoxycarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropoxycarbonyl,
 1,2,2-Trimethylpropoxycarbonyl,
 1-Ethyl-1-methyl-propoxycarbonyl oder
 1-Ethyl-2-methyl-propoxycarbonyl;
- 10
- C₁-C₄-Halogenalkoxycarbonyl: einen C₁-C₄-Alkoxycarbonylrest,
 wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch
 Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.
 Fluormethoxycarbonyl, Difluormethoxycarbonyl,
 15 Trifluormethoxycarbonyl, Chlordifluormethoxycarbonyl,
 Bromdifluormethoxycarbonyl, 2-Fluorethoxycarbonyl,
 2-Chlorethoxycarbonyl, 2-Bromethoxycarbonyl,
 2-Iodethoxycarbonyl, 2,2-Difluorethoxycarbonyl,
 2,2,2-Trifluorethoxycarbonyl, 2-Chlor-2-fluorethoxycarbonyl,
 20 2-Chlor-2,2-difluorethoxycarbonyl,
 2,2-Dichlor-2-fluorethoxycarbonyl,
 2,2,2-Trichlorethoxycarbonyl, Pentafluorethoxycarbonyl,
 2-Fluorpropoxycarbonyl, 3-Fluorpropoxycarbonyl,
 2-Chlorpropoxycarbonyl, 3-Chlorpropoxycarbonyl,
 25 2-Brompropoxycarbonyl, 3-Brompropoxycarbonyl,
 2,2-Difluorpropoxycarbonyl, 2,3-Difluorpropoxycarbonyl,
 2,3-Dichlorpropoxycarbonyl, 3,3,3-Trifluorpropoxycarbonyl,
 3,3,3-Trichlorpropoxycarbonyl,
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxycarbonyl,
 30 Heptafluorpropoxycarbonyl,
 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxycarbonyl,
 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxycarbonyl,
 1-(Brommethyl)-2-bromethoxycarbonyl, 4-Fluorbutoxycarbonyl,
 4-Chlorbutoxycarbonyl, 4-Brombutoxycarbonyl oder
 35 4-Iodbutoxycarbonyl;
- C₁-C₆-Halogenoxycarbonyl: einen C₁-C₄-Halogenoxycarbonylrest
 wie voranstehend genannt, sowie 5-Fluorpentoxycarbonyl,
 5-Chlorpentoxycarbonyl, 5-Brompentoxycarbonyl,
 40 6-Fluorhexoxycarbonyl, 6-Chlorhexoxycarbonyl oder
 6-Bromhexoxycarbonyl;
- (C₁-C₄-Alkyl)carbonyloxy: Acetyloxy, Ethylcarbonyloxy,
 Propylcarbonyloxy, 1-Methylethylcarbonyloxy,
 45 Butylcarbonyloxy, 1-Methylpropylcarbonyloxy,
 2-Methylpropylcarbonyloxy oder 1,1-Dimethylethylcarbonyloxy;

19

- (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl: z.B. Methylaminocarbonyl,
Ethylaminocarbonyl, Propylaminocarbonyl,
1-Methylethylaminocarbonyl, Butylaminocarbonyl,
1-Methylpropylaminocarbonyl, 2-Methylpropylaminocarbonyl oder
5 1,1-Dimethylethylaminocarbonyl;
- (C₁-C₆-Alkylamino)carbonyl: (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl, wie
vorstehend genannt, sowie z.B. Pentylaminocarbonyl,
1-Methylbutylaminocarbonyl, 2-Methylbutylaminocarbonyl,
10 3-Methylbutylaminocarbonyl, 2,2-Dimethylpropylaminocarbonyl,
1-Ethylpropylaminocarbonyl, Hexylaminocarbonyl,
1,1-Dimethylpropylaminocarbonyl,
1,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Methylpentylaminocarbonyl,
2-Methylpentylaminocarbonyl, 3-Methylpentylaminocarbonyl,
15 4-Methylpentylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylbutylaminocarbonyl,
1,2-Dimethylbutylaminocarbonyl,
1,3-Dimethylbutylaminocarbonyl,
2,2-Dimethylbutylaminocarbonyl,
2,3-Dimethylbutylaminocarbonyl,
20 3,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1-Ethylbutylaminocarbonyl,
2-Ethylbutylaminocarbonyl,
1,1,2-Trimethylpropylaminocarbonyl,
1,2,2-Trimethylpropylaminocarbonyl,
1-Ethyl-1-methylpropylaminocarbonyl oder
25 1-Ethyl-2-methylpropylaminocarbonyl;
- Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl: z.B.
N,N-Dimethylaminocarbonyl, N,N-Diethylaminocarbonyl,
N,N-Di-(1-methylethyl)aminocarbonyl,
30 N,N-Dipropylaminocarbonyl, N,N-Dibutylaminocarbonyl,
N,N-Di-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N,N-Di-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,
N-Ethyl-N-methylaminocarbonyl,
35 N-Methyl-N-propylaminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,
N-Butyl-N-methylaminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
40 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminocarbonyl,
N-Ethyl-N-propylaminocarbonyl,
N-Ethyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,
N-Butyl-N-ethylaminocarbonyl,
N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
45 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,
N-(1-Methylethyl)-N-propylaminocarbonyl,

20

- N-Butyl-N-propylaminocarbonyl,
N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl,
N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminocarbonyl,
5 N-Butyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,
N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,
N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
10 N-Butyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,
N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl oder
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl;
- 15
- Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl:
Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl, wie voranstehend genannt,
sowie z.B. N-Methyl-N-pentylaminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-methylbutyl)-aminocarbonyl,
20 N-Methyl-N-(2-methylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(3-methylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-ethylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-hexylaminocarbonyl,
25 N-Methyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-methylpentyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(2-methylpentyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(3-methylpentyl)-aminocarbonyl,
30 N-Methyl-N-(4-methylpentyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
35 N-Methyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-ethylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(2-ethylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl,
40 N-Methyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
N-Ethyl-N-pentylaminocarbonyl,
N-Ethyl-N-(1-methylbutyl)-aminocarbonyl,
45 N-Ethyl-N-(2-methylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Ethyl-N-(3-methylbutyl)-aminocarbonyl,
N-Ethyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,

21

- N-Ethyl-N-(1-ethylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-hexylaminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,
 5 N-Ethyl-N-(1-methylpentyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2-methylpentyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(3-methylpentyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(4-methylpentyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
 10 N-Ethyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,
 15 N-Ethyl-N-(1-ethylbutyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2-ethylbutyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 20 N-Ethyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Propyl-N-pentylaminocarbonyl,
 N-Butyl-N-pentylaminocarbonyl, N,N-Dipentylaminocarbonyl,
 N-Propyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Butyl-N-hexylaminocarbonyl,
 N-Pentyl-N-hexylaminocarbonyl oder N,N-Dihexylaminocarbonyl;
 25
- Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl: z.B.
 N,N-Dimethylaminothiocarbonyl, N,N-Diethylaminothiocarbonyl,
 N,N-Di-(1-methylethyl)aminothiocarbonyl,
 N,N-Dipropylaminothiocarbonyl, N,N-Dibutylaminothiocarbonyl,
 30 N,N-Di-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 N,N-Di-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-methylaminothiocarbonyl,
 N-Methyl-N-propylaminothiocarbonyl,
 35 N-Methyl-N-(1-methylethyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Butyl-N-methylaminothiocarbonyl,
 N-Methyl-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Methyl-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminothiocarbonyl,
 40 N-Ethyl-N-propylaminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1-methylethyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Butyl-N-ethylaminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 45 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminothiocarbonyl,
 N-(1-Methylethyl)-N-propylaminothiocarbonyl,
 N-Butyl-N-propylaminothiocarbonyl,

22

- N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminothiocarbonyl,
N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminothiocarbonyl,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminothiocarbonyl,
N-Butyl-N-(1-methylethyl)-aminothiocarbonyl,
5 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)-aminothiocarbonyl,
N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Butyl-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
10 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminothiocarbonyl,
N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-pentylaminothiocarbonyl,
15 N-Methyl-N-(1-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(2-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(3-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-ethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
20 N-Methyl-N-hexylaminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(2-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,
25 N-Methyl-N-(3-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(4-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
30 N-Methyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(2-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
35 N-Methyl-N-ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Methyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Ethyl-N-pentylaminothiocarbonyl,
40 N-Ethyl-N-(1-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Ethyl-N-(2-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Ethyl-N-(3-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,
N-Ethyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Ethyl-N-(1-ethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
45 N-Ethyl-N-hexylaminothiocarbonyl,
N-Ethyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
N-Ethyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,

23

- N-Ethyl-N-(1-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(3-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(4-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,
 5 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
 10 N-Ethyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 15 N-Ethyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,
 N-Propyl-N-pentylaminothiocarbonyl,
 N-Butyl-N-pentylaminothiocarbonyl,
 N,N-Dipentylaminothiocarbonyl,
 20 N-Propyl-N-hexylaminothiocarbonyl,
 N-Butyl-N-hexylaminothiocarbonyl,
 N-Pentyl-N-hexylaminothiocarbonyl oder
 N,N-Dihexylaminothiocarbonyl;
- 25 - C₁-C₆-Hydroxyalkyl: durch ein bis drei OH-Gruppen substituier-
 tes C₁-C₆-Alkyl, z.B. Hydroxymethyl, 1-Hydroxyethyl, 2-Hydro-
 xyethyl, 1,2-Bishydroxyethyl, 1-Hydroxypropyl, 2-Hydroxypro-
 pyl, 3-Hydroxypropyl, 4-Hydroxybutyl, 2,2-Dimethyl-3-hydroxy-
 propyl;
- 30 - Phenyl-C₁-C₆-alkyl: durch einen Phenylrest substituiertes
 C₁-C₆-Alkyl, z.B. Benzyl, 1-Phenylethyl und 2-Phenylethyl,
 wobei der Phenylrest in der angegebenen Weise teilweise oder
 vollständig halogeniert sein kann oder einen bis drei der für
 35 Phenyl oben angegebenen Substituenten aufweisen kann;
 Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl steht dementsprechend für ein durch
 einen Heterocyclylrest substituiertes C₁-C₆-Alkyl;
- C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl: durch C₁-C₆-Alkoxy, wie vorstehend
 40 genannt, substituiertes C₁-C₆-Alkyl, also z.B. Methoxymethyl,
 Ethoxymethyl, Propoxymethyl, (1-Methylethoxy)methyl,
 Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl,
 (2-Methylpropoxy)-methyl, (1,1-Dimethylethoxy)methyl,
 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(Propoxy)ethyl,
 45 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(Butoxy)ethyl,
 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl,
 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)-propyl,

24

- 2-(Ethoxy)propyl, 2-(Propoxy)propyl,
 2-(1-Methylethoxy)-propyl, 2-(Butoxy)propyl,
 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl,
 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl,
 5 3-(Ethoxy)-propyl, 3-(Propoxy)propyl,
 3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(Butoxy)propyl,
 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl,
 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl,
 2-(Ethoxy)butyl, 2-(Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl,
 10 2-(Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl,
 2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl,
 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)butyl, 3-(Propoxy)butyl,
 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(Butoxy)-butyl,
 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl,
 15 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl,
 4-(Ethoxy)-butyl, 4-(Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl,
 4-(Butoxy)-butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl,
 4-(2-Methylpropoxy)butyl oder 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl;
- 20 - C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkoxy, sowie die Alkoxyalkoxyteile von
 C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkoxycarbonyl: durch C₁-C₆-Alkoxy, wie
 vorstehend genannt, substituiertes C₁-C₆-Alkoxy, also z.B. für
 Methoxymethoxy, Ethoxymethoxy, Propoxymethoxy,
 (1-Methylethoxy)methoxy, Butoxymethoxy,
 25 (1-Methylpropoxy)methoxy, (2-Methylpropoxy)methoxy,
 (1,1-Dimethylethoxy)methoxy, 2-(Methoxy)ethoxy,
 2-(Ethoxy)ethoxy, 2-(Propoxy)ethoxy,
 2-(1-Methylethoxy)ethoxy, 2-(Butoxy)ethoxy,
 2-(1-Methylpropoxy)ethoxy, 2-(2-Methylpropoxy)ethoxy,
 30 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethoxy, 2-(Methoxy)propoxy,
 2-(Ethoxy)propoxy, 2-(Propoxy)propoxy,
 2-(1-Methylethoxy)propoxy, 2-(Butoxy)-propoxy,
 2-(1-Methylpropoxy)propoxy, 2-(2-Methylpropoxy)propoxy,
 2-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 3-(Methoxy)-propoxy,
 35 3-(Ethoxy)propoxy, 3-(Propoxy)propoxy,
 3-(1-Methylethoxy)propoxy, 3-(Butoxy)propoxy,
 3-(1-Methylpropoxy)-propoxy, 3-(2-Methylpropoxy)propoxy,
 3-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 2-(Methoxy)butoxy,
 2-(Ethoxy)butoxy, 2-(Propoxy)butoxy,
 40 2-(1-Methylethoxy)butoxy, 2-(Butoxy)-butoxy,
 2-(1-Methylpropoxy)butoxy, 2-(2-Methylpropoxy)butoxy,
 2-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 3-(Methoxy)butoxy,
 3-(Ethoxy)-butoxy, 3-(Propoxy)butoxy,
 3-(1-Methylethoxy)butoxy, 3-(Butoxy)butoxy,
 45 3-(1-Methylpropoxy)butoxy, 3-(2-Methylpropoxy)butoxy,
 3-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 4-(Methoxy)-butoxy,
 4-(Ethoxy)butoxy, 4-(Propoxy)butoxy,

25

- 4-(1-Methylethoxy)butoxy, 4-(Butoxy)butoxy,
 4-(1-Methylpropoxy)butoxy, 4-(2-Methylpropoxy)butoxy oder
 4-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy;
- 5 - C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl: Durch eine
 C₁-C₆-Alkylcarbonylgruppe substituiertes C₁-C₆-Alkyl, worin
 beide der C₁-C₆-Alkylgruppen ein oder mehrere Substituenten,
 ausgewählt unter C₁-C₄-Alkoxy und/oder Hydroxy aufweisen
 können: z.B. Acetylmethyl (=2-Oxopropyl), 2-(Acetyl)ethyl
 10 (=3-Oxo-n-butyl), 3-Oxo-n-pentyl, 1,1-Dimethyl-2-oxopropyl,
 3-Hydroxy-2-oxopropyl oder 3-Hydroxy-2-oxobutyl.
- C₃-C₆-Alkenyl, sowie die Alkenylteile von
 C₃-C₆-Alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxy,
 15 C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl,
 N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl,
 N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)aminocarbonyl: z.B.
 Prop-2-en-1-yl, But-1-en-4-yl, 1-Methyl-prop-2-en-1-yl,
 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, 2-Buten-1-yl, 1-Penten-3-yl,
 20 1-Penten-4-yl, 2-Penten-4-yl, 1-Methyl-but-2-en-1-yl,
 2-Methyl-but-2-en-1-yl, 3-Methyl-but-2-en-1-yl,
 1-Methyl-but-3-en-1-yl, 2-Methyl-but-3-en-1-yl,
 3-Methyl-but-3-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl,
 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl,
 25 Hex-3-en-1-yl, Hex-4-en-1-yl, Hex-5-en-1-yl,
 1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl,
 3-Methyl-pent-3-en-1-yl, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl,
 1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl,
 3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl,
 30 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
 35 1-Ethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-3-en-1-yl,
 2-Ethyl-but-2-en-1-yl, 2-Ethyl-but-3-en-1-yl,
 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl,
 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl oder
 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl;
- 40 - C₂-C₆-Alkenyl, sowie die Alkenylteile von
 C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, Phenyl-C₂-C₆-alkenylcarbonyl und
 Heterocyclyl-C₂-C₆-alkenylcarbonyl: C₃-C₆-Alkenyl, wie
 voranstehend genannt, sowie Ethenyl;
- 45

26

- C₃–C₆–Halogenalkenyl: einen C₃–C₆–Alkenylrest, wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. 2–Chlorallyl, 3–Chlorallyl, 2,3–Dichlorallyl, 3,3–Dichlorallyl, 2,3,3–Tri–chlorallyl, 2,3–Dichlorbut–2–enyl, 2–Bromallyl, 3–Bromallyl, 2,3–Dibromallyl, 3,3–Dibromallyl, 2,3,3–Tribromallyl oder 2,3–Dibrombut–2–enyl;
- C₃–C₆–Alkinyl, sowie die Alkinylteile von C₃–C₆–Alkinylcarbonyl, C₃–C₆–Alkinyloxy, C₃–C₆–Alkinyloxycarbonyl, C₃–C₆–Alkinylaminocarbonyl, N–(C₃–C₆–Alkinyl)–N–(C₁–C₆–alkyl)–aminocarbonyl, N–(C₃–C₆–Alkinyl)–N–(C₁–C₆–alkoxyaminocarbonyl: z.B. Propargyl, But–1–in–3–yl, But–1–in–4–yl, But–2–in–1–yl, Pent–1–in–3–yl, Pent–1–in–4–yl, Pent–1–in–5–yl, Pent–2–in–1–yl, Pent–2–in–4–yl, Pent–2–in–5–yl, 3–Methyl–but–1–in–3–yl, 3–Methyl–but–1–in–4–yl, Hex–1–in–3–yl, Hex–1–in–4–yl, Hex–1–in–5–yl, Hex–1–in–6–yl, Hex–2–in–1–yl, Hex–2–in–4–yl, Hex–2–in–5–yl, Hex–2–in–6–yl, Hex–3–in–1–yl, Hex–3–in–2–yl, 3–Methyl–pent–1–in–3–yl, 3–Methyl–pent–1–in–4–yl, 3–Methyl–pent–1–in–5–yl, 4–Methyl–pent–2–in–4–yl oder 4–Methyl–pent–2–in–5–yl;
- C₂–C₆–Alkinyl, sowie die Alkinylteile von C₂–C₆–Alkinylcarbonyl: C₃–C₆–Alkinyl, wie voranstehend genannt, sowie Ethinyl;
- C₃–C₆–Halogenalkinyl: einen C₃–C₆–Alkinylrest, wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. 1,1–Difluor–prop–2–in–1–yl, 3–Iod–prop–2–in–1–yl, 4–Fluorbut–2–in–1–yl, 4–Chlorbut–2–in–1–yl, 1,1–Difluorbut–2–in–1–yl, 4–Iod–but–3–in–1–yl, 5–Fluorpent–3–in–1–yl, 5–Iod–pent–4–in–1–yl, 6–Fluor–hex–4–in–1–yl oder 6–Iod–hex–5–in–1–yl;
- C₁–C₆–Alkandiyl: Methandiyl, Ethan–1,1–diyl, Ethan–1,2–diyl, Propan–1,1–diyl, Propan–1,2–diyl, Propan–1,3–diyl, Propan–2,2–diyl, Butan–1,1–diyl, Butan–1,2–diyl, Butan–1,3–diyl, Butan–1,4–diyl, 2–Methyl–propan–1,3–diyl, 2–Methyl–propan–1,2–diyl, 2–Methyl–propan–1,1–diyl, 1–Methyl–propan–1,2–diyl, 1–Methyl–propan–2,2–diyl, 1–Methyl–propan–1,1–diyl, Pentan–1,1–diyl, Pentan–1,2–diyl, Pentan–1,3–diyl, Pentan–1,5–diyl, Pentan–2,3–diyl, Pentan–2,2–diyl, 1–Methyl–butan–1,1–diyl, 1–Methyl–butan–1,2–diyl, 1–Methyl–butan–1,3–diyl, 1–Methyl–butan–1,4–diyl, 2–Methyl–butan–1,1–diyl,

27

- 2-Methyl-butan-1,2-diyl, 2-Methyl-butan-1,3-diyl,
 2-Methyl-butan-1,4-diyl, 2,2-Dimethyl-propan-1,1-diyl,
 2,2-Dimethyl-propan-1,3-diyl, 1,1-Dimethyl-propan-1,3-diyl,
 1,1-Dimethyl-propan-1,2-diyl, 2,3-Dimethyl-propan-1,3-diyl,
 5 2,3-Dimethyl-propan-1,2-diyl, 1,3-Dimethyl-propan-1,3-diyl,
 Hexan-1,1-diyl, Hexan-1,2-diyl, Hexan-1,3-diyl,
 Hexan-1,4-diyl-, Hexan-1,5-diyl, Hexan-1,6-diyl,
 Hexan-2,5-diyl, 2-Methyl-pentan-1,1-diyl,
 1-Methyl-pentan-1,2-diyl, 1-Methyl-pentan-1,3-diyl,
 10 1-Methyl-pentan-1,4-diyl, 1-Methyl-pentan-1,5-diyl,
 2-Methyl-pentan-1,1-diyl, 2-Methyl-pentan-1,2-diyl,
 2-Methyl-pentan-1,3-diyl, 2-Methyl-pentan-1,4-diyl,
 2-Methyl-pentan-1,5-diyl, 3-Methyl-pentan-1,1-diyl,
 3-Methyl-pentan-1,2-diyl, 3-Methyl-pentan-1,3-diyl,
 15 3-Methyl-pentan-1,4-diyl, 3-Methyl-pentan-1,5-diyl,
 1,1-Dimethyl-butan-1,2-diyl, 1,1-Dimethyl-butan-1,3-diyl,
 1,1-Dimethyl-butan-1,4-diyl, 1,2-Dimethyl-butan-1,1-diyl,
 1,2-Dimethyl-butan-1,2-diyl, 1,2-Dimethyl-butan-1,3-diyl,
 1,2-Dimethyl-butan-1,4-diyl, 1,3-Dimethyl-butan-1,1-diyl,
 20 1,3-Dimethyl-butan-1,2-diyl, 1,3-Dimethyl-butan-1,3-diyl,
 1,3-Dimethyl-butan-1,4-diyl, 1-Ethyl-butan-1,1-diyl,
 1-Ethyl-butan-1,2-diyl, 1-Ethyl-butan-1,3-diyl,
 1-Ethyl-butan-1,4-diyl, 2-Ethyl-butan-1,1-diyl,
 2-Ethyl-butan-1,2-diyl, 2-Ethyl-butan-1,3-diyl,
 25 2-Ethyl-butan-1,4-diyl, 2-Ethyl-butan-2,3-diyl,
 2,2-Dimethyl-butan-1,1-diyl, 2,2-Dimethyl-butan-1,3-diyl,
 2,2-Dimethyl-butan-1,4-diyl, 1-Isopropyl-propan-1,1-diyl,
 1-Isopropyl-propan-1,2-diyl, 1-Isopropyl-propan-1,3-diyl,
 2-Isopropyl-propan-1,1-diyl, 2-Isopropyl-propan-1,2-diyl,
 30 2-Isopropyl-propan-1,3-diyl, 1,2,3-Trimethyl-propan-1,1-diyl,
 1,2,3-Trimethyl-propan-1,2-diyl oder
 1,2,3-Trimethyl-propan-1,3-diyl;
- C₂-C₆-Alkendiyl: Ethen-1,1-diyl, Ethen-1,2-diyl,
 35 1-Propen-1,1-diyl, 1-Propen-1,2-diyl, 1-Propen-1,3-diyl,
 2-Propen-1,1-diyl, 2-Propen-1,2-diyl, 2-Propen-1,3-diyl,
 1-Buten-1,1-diyl, 1-Buten-1,2-diyl, 1-Buten-1,3-diyl,
 1-Buten-1,4-diyl, 2-Buten-1,1-diyl, 2-Buten-1,2-diyl,
 2-Buten-1,3-diyl, 2-Buten-1,4-diyl, 3-Buten-1,1-diyl,
 40 3-Buten-1,2-diyl, 3-Buten-1,3-diyl, 3-Buten-1,4-diyl,
 1-Methyl-1-propen-1,2-diyl, 1-Methyl-1-propen-1,3-diyl,
 1-Methyl-2-propen-1,1-diyl, 1-Methyl-2-propen-1,2-diyl,
 1-Methyl-2-propen-1,3-diyl, 2-Methyl-1,1-propen-1,1-diyl,
 2-Methyl-1-propen-1,3-diyl, 3-Buten-1,1-diyl,
 45 3-Buten-1,2-diyl, 3-Buten-1,3-diyl, 3-Buten-1,4-diyl,
 1-Penten-1,1-diyl, 1-Penten-1,2-diyl, 1-Penten-1,3-diyl,
 1-Penten-1,4-diyl, 1-Penten-1,5-diyl, 1-Hexen-1,1-diyl,

28

- 1-Hexen-1,2-diyl, 1-Hexen-1,3-diyl, 1-Hexen-1,4-diyl,
1-Hexen-1,5-diyl oder 1-Hexen-1,6-diyl;
- C₂-C₆-Alkadiendiyl: 1,3-Butadien-1,1-diyl,
5 1,3-Butadien-1,2-diyl, 1,3-Butadien-1,3-diyl,
1,3-Butadien-1,4-diyl, 1,3-Pentadien-1,1-diyl,
1,3-Pentadien-1,2-diyl, 1,3-Pentadien-1,3-diyl,
1,3-Pentadien-1,4-diyl, 1,3-Pentadien-1,5-diyl,
2,4-Pentadien-1,1-diyl, 2,4-Pentadien-1,2-diyl,
10 2,4-Pentadien-1,3-diyl, 2,4-Pentadien-1,4-diyl,
2,4-Pentadien-1,5-diyl, 1-Methyl-1,3-butadien-1,4-diyl,
1,3-Hexadien-1,1-diyl, 1,3-Hexadien-1,2-diyl,
1,3-Hexadien-1,3-diyl, 1,3-Hexadien-1,4-diyl,
1,3-Hexadien-1,5-diyl, 1,3-Hexadien-1,6-diyl,
15 1-Methyl-1,3-pentadien-1,2-diyl,
1-Methyl-1,3-pentadien-1,3-diyl,
1-Methyl-1,3-pentadien-1,4-diyl oder
1-Methyl-1,3-pentadien-1,5-diyl;
- 20 - C₂-C₆-Alkindiyl: Ethin-1,2-diyl, 1-Propin-1,3-diyl,
2-Propin-1,1-diyl, 2-Propin-1,3-diyl, 1-Butin-1,3-diyl,
1-Butin-1,4-diyl, 2-Butin-1,1-diyl, 2-Butin-1,4-diyl,
1-Methyl-2-propin-1,1-diyl, 1-Methyl-2-propin-1,3-diyl,
1-Pentin-1,3-diyl, 1-Pentin-1,4-diyl, 1-Pentin-1,5-diyl,
25 2-Pentin-1,1-diyl, 2-Pentin-1,4-diyl, 2-Pentin-1,5-diyl,
3-Pentin-1,1-diyl, 3-Pentin-1,2-diyl, 3-Pentin-1,5-diyl,
4-Pentin-1,1-diyl, 4-Pentin-1,2-diyl, 4-Pentin-1,3-diyl,
4-Pentin-1,5-diyl, 1-Hexin-1,3-diyl, 1-Hexin-1,4-diyl,
1-Hexin-1,5-diyl, 1-Hexin-1,6-diyl, 2-Hexin-1,1-diyl,
30 2-Hexin-1,4-diyl, 2-Hexin-1,5-diyl, 2-Hexin-1,6-diyl,
3-Hexin-1,1-diyl, 3-Hexin-1,2-diyl, 3-Hexin-1,5-diyl,
3-Hexin-1,6-diyl, 4-Hexin-1,1-diyl, 4-Hexin-1,2-diyl,
4-Hexin-1,3-diyl, 4-Hexin-1,6-diyl, 5-Hexin-1,1-diyl,
5-Hexin-1,2-diyl, 5-Hexin-1,3-diyl, 5-Hexin-1,4-diyl oder
35 5-Hexin-1,6-diyl;
- C₃-C₆-Cycloalkyl, sowie die Cycloalkylteile von
C₃-C₆-Cycloalkylamino und C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl: z.B.
Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl;
40
- Heterocyclyl, sowie Heterocyclylteile von Heterocyclyloxy,
Heterocyclylcarbonyl, Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl,
Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, Heterocyclylsulfonyl oder
Heterocyclylsulfonyl, Heterocyclylsulfonyl,
45 Heterocyclylsulfonyl,
Heterocyclylsulfonyl,
Heterocyclyl-C₂-C₆-alkenylcarbonyl,
Heterocyclylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl,

N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(heterocyclyl)-aminocarbonyl,
 Heterocyclylaminocarbonyl: ein gesättigter, partiell
 gesättigter oder ungesättigter 5- oder 6-gliedriger,
 heterocyclischer Ring, der ein, zwei, drei oder vier gleiche
 5 oder verschiedene Heteroatome, ausgewählt aus folgender
 Gruppe: Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, enthält, also
 z.B. C-gebundene 5-gliedrige Ringe wie:

10 Tetrahydrofuran-2-yl, Tetrahydrofuran-3-yl,
 Tetrahydrothien-2-yl, Tetrahydrothien-3-yl,
 Tetrahydropyrrol-2-yl, Tetrahydropyrrol-3-yl,
 2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl,
 2,5-Dihydrofuran-2-yl, 2,5-Dihydrofuran-3-yl,
 4,5-Dihydrofuran-2-yl, 4,5-Dihydrofuran-3-yl,
 15 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl,
 2,5-Dihydrothien-2-yl, 2,5-Dihydrothien-3-yl,
 4,5-Dihydrothien-2-yl, 4,5-Dihydrothien-3-yl,
 2,3-Dihydro-1H-pyrrol-2-yl, 2,3-Dihydro-1H-pyrrol-3-yl,
 2,5-Dihydro-1H-pyrrol-2-yl, 2,5-Dihydro-1H-pyrrol-3-yl,
 20 4,5-Dihydro-1H-pyrrol-2-yl, 4,5-Dihydro-1H-pyrrol-3-yl,
 3,4-Dihydro-2H-pyrrol-2-yl, 3,4-Dihydro-2H-pyrrol-3-yl,
 3,4-Dihydro-5H-pyrrol-2-yl, 3,4-Dihydro-5H-pyrrol-3-yl,
 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, Pyrrol-2-yl,
 Pyrrol-3-yl, Tetrahydropyrazol-3-yl, Tetrahydropyrazol-4-yl,
 25 Tetrahydroisoxazol-3-yl, Tetrahydroisoxazol-4-yl,
 Tetrahydroisoxazol-5-yl, 1,2-Oxathiolan-3-yl,
 1,2-Oxathiolan-4-yl, 1,2-Oxathiolan-5-yl,
 Tetrahydroisothiazol-3-yl, Tetrahydroisothiazol-4-yl,
 Tetrahydroisothiazol-5-yl, 1,2-Dithiolan-3-yl,
 30 1,2-Dithiolan-4-yl, Tetrahydroimidazol-2-yl,
 Tetrahydroimidazol-4-yl, Tetrahydrooxazol-2-yl,
 Tetrahydrooxazol-4-yl, Tetrahydrooxazol-5-yl,
 Tetrahydrothiazol-2-yl, Tetrahydrothiazol-4-yl,
 Tetrahydrothiazol-5-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl,
 35 1,3-Dioxolan-4-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-4-yl,
 1,3-Oxathiolan-5-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl, 1,3-Dithiolan-4-yl,
 4,5-Dihydro-1H-pyrazol-3-yl, 4,5-Dihydro-1H-pyrazol-4-yl,
 4,5-Dihydro-1H-pyrazol-5-yl, 2,5-Dihydro-1H-pyrazol-3-yl,
 2,5-Dihydro-1H-pyrazol-4-yl, 2,5-Dihydro-1H-pyrazol-5-yl,
 40 4,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl,
 4,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-3-yl,
 2,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-5-yl,
 2,3-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-4-yl,
 2,3-Dihydroisoxazol-5-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-3-yl,
 45 4,5-Dihydroisothiazol-4-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-5-yl,
 2,5-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-4-yl,
 2,5-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-3-yl,

30

- 2,3-Dihydroisothiazol-4-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-5-yl,
 Δ^3 -1,2-Dithiol-3-yl, Δ^3 -1,2-Dithiol-4-yl,
 Δ^3 -1,2-Dithiol-5-yl, 4,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl,
4,5-Dihydro-1H-imidazol-4-yl, 4,5-Dihydro-1H-imidazol-5-yl,
5 2,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl, 2,5-Dihydro-1H-imidazol-4-yl,
2,5-Dihydro-1H-imidazol-5-yl, 2,3-Dihydro-1H-imidazol-2-yl,
2,3-Dihydro-1H-imidazol-4-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl,
4,5-Dihydrooxazol-4-yl, 4,5-Dihydrooxazol-5-yl,
2,5-Dihydrooxazol-2-yl, 2,5-Dihydrooxazol-4-yl,
10 2,5-Dihydrooxazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl,
2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl,
4,5-Dihydrothiazol-2-yl, 4,5-Dihydrothiazol-4-yl,
4,5-Dihydrothiazol-5-yl, 2,5-Dihydrothiazol-2-yl,
2,5-Dihydrothiazol-4-yl, 2,5-Dihydrothiazol-5-yl,
15 2,3-Dihydrothiazol-2-yl, 2,3-Dihydrothiazol-4-yl,
2,3-Dihydrothiazol-5-yl, 1,3-Dioxol-2-yl, 1,3-Dioxol-4-yl,
1,3-Dithiol-2-yl, 1,3-Dithiol-4-yl, 1,3-Oxathiol-2-yl,
1,3-Oxathiol-4-yl, 1,3-Oxathiol-5-yl, Pyrazol-3-yl,
Pyrazol-4-yl, Isoxazol-3-yl, Isoxazol-4-yl, Isoxazol-5-yl,
20 Isothiazol-3-yl, Isothiazol-4-yl, Isothiazol-5-yl,
Imidazol-2-yl, Imidazol-4-yl, Oxazol-2-yl, Oxazol-4-yl,
Oxazol-5-yl, Thiazol-2-yl, Thiazol-4-yl, Thiazol-5-yl,
1,2,3- Δ^2 -Oxadiazolin-4-yl, 1,2,3- Δ^2 -Oxadiazolin-5-yl,
1,2,4- Δ^4 -Oxadiazolin-3-yl, 1,2,4- Δ^4 -Oxadiazolin-5-yl,
25 1,2,4- Δ^2 -Oxadiazolin-3-yl, 1,2,4- Δ^2 -Oxadiazolin-5-yl,
1,2,4- Δ^3 -Oxadiazolin-3-yl, 1,2,4- Δ^3 -Oxadiazolin-5-yl,
1,3,4- Δ^2 -Oxadiazolin-2-yl, 1,3,4- Δ^2 -Oxadiazolin-5-yl,
1,3,4- Δ^3 -Oxadiazolin-2-yl, 1,3,4-Oxadiazolin-2-yl,
1,2,4- Δ^4 -Thiadiazolin-3-yl, 1,2,4- Δ^4 -Thiadiazolin-5-yl,
30 1,2,4- Δ^3 -Thiadiazolin-3-yl, 1,2,4- Δ^3 -Thiadiazolin-5-yl,
1,2,4- Δ^2 -Thiadiazolin-3-yl, 1,2,4- Δ^2 -Thiadiazolin-5-yl,
1,3,4- Δ^2 -Thiadiazolin-2-yl, 1,3,4- Δ^2 -Thiadiazolin-5-yl,
1,3,4- Δ^3 -Thiadiazolin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolin-2-yl,
1,3,2-Dioxathiolan-4-yl, 1,2,3- Δ^2 -Triazolin-4-yl,
35 1,2,3- Δ^2 -Triazolin-5-yl, 1,2,4- Δ^2 -Triazolin-3-yl,
1,2,4- Δ^2 -Triazolin-5-yl, 1,2,4- Δ^3 -Triazolin-3-yl,
1,2,4- Δ^3 -Triazolin-5-yl, 1,2,4- Δ^1 -Triazolin-2-yl,
1,2,4-Triazolin-3-yl, 3H-1,2,4-Dithiazol-5-yl,
2H-1,3,4-Dithiazol-5-yl, 2H-1,3,4-Oxathiazol-5-yl,
40 1,2,3-Oxadiazol-4-yl, 1,2,3-Oxadiazol-5-yl,
1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl,
1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,2,3-Thiadiazol-4-yl,
1,2,3-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl,
1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,3,4-Thiadiazolyl-2-yl,
45 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, Tetrazol-5-yl;

31

C-gebundene 6-gliedrige Ringe wie:

- Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl,
 Tetrahydropyran-4-yl, Piperidin-2-yl, Piperidin-3-yl,
 5 Piperidin-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl,
 Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl,
 2H-3,4-Dihydropyran-6-yl, 2H-3,4-Dihydropyran-5-yl,
 2H-3,4-Dihydropyran-4-yl, 2H-3,4-Dihydropyran-3-yl,
 2H-3,4-Dihydropyran-2-yl, 2H-3,4-Dihydropyran-6-yl,
 10 2H-3,4-Dihydrothiopyran-5-yl, 2H-3,4-Dihydrothiopyran-4-yl,
 2H-3,4-Dihydropyran-3-yl, 2H-3,4-Dihydropyran-2-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-6-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-5-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-4-yl,
 15 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-3-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-2-yl, 2H-5,6-Dihydropyran-2-yl,
 2H-5,6-Dihydropyran-3-yl, 2H-5,6-Dihydropyran-4-yl,
 2H-5,6-Dihydropyran-5-yl, 2H-5,6-Dihydropyran-6-yl,
 20 2H-5,6-Dihydrothiopyran-2-yl, 2H-5,6-Dihydrothiopyran-3-yl,
 2H-5,6-Dihydrothiopyran-4-yl, 2H-5,6-Dihydrothiopyran-5-yl,
 2H-5,6-Dihydrothiopyran-6-yl, 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-2-yl,
 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-3-yl,
 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-4-yl,
 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-5-yl,
 25 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-6-yl,
 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-2-yl,
 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-3-yl,
 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-4-yl,
 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-5-yl,
 30 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-6-yl, 4H-Pyran-2-yl, 4H-Pyran-3-yl,
 4H-Pyran-4-yl, 4H-Thiopyran-2-yl, 4H-Thiopyran-3-yl,
 4H-Thiopyran-4-yl, 1,4-Dihydropyridin-2-yl,
 1,4-Dihydropyridin-3-yl, 1,4-Dihydropyridin-4-yl,
 2H-Pyran-2-yl, 2H-Pyran-3-yl, 2H-Pyran-4-yl, 2H-Pyran-5-yl,
 35 2H-Pyran-6-yl, 2H-Thiopyran-2-yl, 2H-Thiopyran-3-yl,
 2H-Thiopyran-4-yl, 2H-Thiopyran-5-yl, 2H-Thiopyran-6-yl,
 1,2-Dihydropyridin-2-yl, 1,2-Dihydropyridin-3-yl,
 1,2-Dihydropyridin-4-yl, 1,2-Dihydropyridin-5-yl,
 1,2-Dihydropyridin-6-yl, 3,4-Dihydropyridin-2-yl,
 40 3,4-Dihydropyridin-3-yl, 3,4-Dihydropyridin-4-yl,
 3,4-Dihydropyridin-5-yl, 3,4-Dihydropyridin-6-yl,
 2,5-Dihydropyridin-2-yl, 2,5-Dihydropyridin-3-yl,
 2,5-Dihydropyridin-4-yl, 2,5-Dihydropyridin-5-yl,
 2,5-Dihydropyridin-6-yl, 2,3-Dihydropyridin-2-yl,
 45 2,3-Dihydropyridin-3-yl, 2,3-Dihydropyridin-4-yl,
 2,3-Dihydropyridin-5-yl, 2,3-Dihydropyridin-6-yl,
 Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, 1,3-Dioxan-2-yl,

32

- 1,3-Dioxan-4-yl, 1,3-Dioxan-5-yl, 1,4-Dioxan-2-yl,
1,3-Dithian-2-yl, 1,3-Dithian-4-yl, 1,3-Dithian-5-yl,
1,4-Dithian-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Oxathian-4-yl,
1,3-Oxathian-5-yl, 1,3-Oxathian-6-yl, 1,4-Oxathian-2-yl,
5 1,4-Oxathian-3-yl, 1,2-Dithian-3-yl, 1,2-Dithian-4-yl,
Hexahydropyrimidin-2-yl, Hexahydropyrimidin-4-yl,
Hexahydropyrimidin-5-yl, Hexahydropyrazin-2-yl,
Hexahydropyridazin-3-yl, Hexahydropyridazin-4-yl,
Tetrahydro-1,3-oxazin-2-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-4-yl,
10 Tetrahydro-1,3-oxazin-5-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-6-yl,
Tetrahydro-1,3-thiazin-2-yl, Tetrahydro-1,3-thiazin-4-yl,
Tetrahydro-1,3-thiazin-5-yl, Tetrahydro-1,3-thiazin-6-yl,
Tetrahydro-1,4-thiazin-2-yl, Tetrahydro-1,4-thiazin-3-yl,
Tetrahydro-1,4-oxazin-2-yl, Tetrahydro-1,4-oxazin-3-yl,
15 Tetrahydro-1,2-oxazin-3-yl, Tetrahydro-1,2-oxazin-4-yl,
Tetrahydro-1,2-oxazin-5-yl, Tetrahydro-1,2-oxazin-6-yl,
2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-3-yl,
2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-4-yl,
2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-5-yl,
20 2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-6-yl,
2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-3-yl,
2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-4-yl,
2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-5-yl,
2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-6-yl,
25 4H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-3-yl,
4H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-4-yl,
4H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-5-yl,
4H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-6-yl,
4H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-3-yl,
30 4H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-4-yl,
4H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-5-yl,
4H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-6-yl,
2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-3-yl,
2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-4-yl,
35 2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-5-yl,
2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-6-yl,
2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-3-yl,
2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-4-yl,
2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-5-yl,
40 2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-6-yl,
2H-3,4-Dihydro-1,2-oxazin-3-yl,
2H-3,4-Dihydro-1,2-oxazin-4-yl,
2H-3,4-Dihydro-1,2-oxazin-5-yl,
2H-3,4-Dihydro-1,2-oxazin-6-yl,
45 2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-3-yl,
2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-4-yl,
2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-5-yl,

33

- 2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-6-yl,
 2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-3-yl,
 2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-4-yl,
 2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-5-yl,
 5 2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-6-yl,
 3,4,5,6-Tetrahydropyridazin-3-yl,
 3,4,5,6-Tetrahydropyridazin-4-yl,
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-3-yl,
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-4-yl,
 10 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-5-yl,
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-6-yl,
 1,2,3,6-Tetrahydropyridazin-3-yl,
 1,2,3,6-Tetrahydropyridazin-4-yl,
 4H-5,6-Dihydro-1,3-oxazin-2-yl,
 15 4H-5,6-Dihydro-1,3-oxazin-4-yl,
 4H-5,6-Dihydro-1,3-oxazin-5-yl,
 4H-5,6-Dihydro-1,3-oxazin-6-yl,
 4H-5,6-Dihydro-1,3-thiazin-2-yl,
 4H-5,6-Dihydro-1,3-thiazin-4-yl,
 20 4H-5,6-Dihydro-1,3-thiazin-5-yl,
 4H-5,6-Dihydro-1,3-thiazin-6-yl,
 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-2-yl,
 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-4-yl,
 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-5-yl,
 25 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-6-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyrazin-2-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyrazin-5-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-2-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-4-yl,
 30 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-5-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-6-yl,
 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-2-yl, 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-3-yl,
 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-5-yl, 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-6-yl,
 2H-1,2-Oxazin-3-yl, 2H-1,2-Oxazin-4-yl, 2H-1,2-Oxazin-5-yl,
 35 2H-1,2-Oxazin-6-yl, 2H-1,2-Thiazin-3-yl, 2H-1,2-Thiazin-4-yl,
 2H-1,2-Thiazin-5-yl, 2H-1,2-Thiazin-6-yl, 4H-1,2-Oxazin-3-yl,
 4H-1,2-Oxazin-4-yl, 4H-1,2-Oxazin-5-yl, 4H-1,2-Oxazin-6-yl,
 4H-1,2-Thiazin-3-yl, 4H-1,2-Thiazin-4-yl,
 4H-1,2-Thiazin-5-yl, 4H-1,2-Thiazin-6-yl, 6H-1,2-Oxazin-3-yl,
 40 6H-1,2-Oxazin-4-yl, 6H-1,2-Oxazin-5-yl, 6H-1,2-Oxazin-6-yl,
 6H-1,2-Thiazin-3-yl, 6H-1,2-Thiazin-4-yl,
 6H-1,2-Thiazin-5-yl, 6H-1,2-Thiazin-6-yl, 2H-1,3-Oxazin-2-yl,
 2H-1,3-Oxazin-4-yl, 2H-1,3-Oxazin-5-yl, 2H-1,3-Oxazin-6-yl,
 2H-1,3-Thiazin-2-yl, 2H-1,3-Thiazin-4-yl,
 45 2H-1,3-Thiazin-5-yl, 2H-1,3-Thiazin-6-yl, 4H-1,3-Oxazin-2-yl,
 4H-1,3-Oxazin-4-yl, 4H-1,3-Oxazin-5-yl, 4H-1,3-Oxazin-6-yl,
 4H-1,3-Thiazin-2-yl, 4H-1,3-Thiazin-4-yl,

34

- 4H-1,3-Thiazin-5-yl, 4H-1,3-Thiazin-6-yl, 6H-1,3-Oxazin-2-yl,
 6H-1,3-Oxazin-4-yl, 6H-1,3-Oxazin-5-yl, 6H-1,3-Oxazin-6-yl,
 6H-1,3-Thiazin-2-yl, 6H-1,3-Oxazin-4-yl, 6H-1,3-Oxazin-5-yl,
 6H-1,3-Thiazin-6-yl, 2H-1,4-Oxazin-2-yl, 2H-1,4-Oxazin-3-yl,
 5 2H-1,4-Oxazin-5-yl, 2H-1,4-Oxazin-6-yl, 2H-1,4-Thiazin-2-yl,
 2H-1,4-Thiazin-3-yl, 2H-1,4-Thiazin-5-yl,
 2H-1,4-Thiazin-6-yl, 4H-1,4-Oxazin-2-yl, 4H-1,4-Oxazin-3-yl,
 4H-1,4-Thiazin-2-yl, 4H-1,4-Thiazin-3-yl,
 1,4-Dihydropyridazin-3-yl, 1,4-Dihydropyridazin-4-yl,
 10 1,4-Dihydropyridazin-5-yl, 1,4-Dihydropyridazin-6-yl,
 1,4-Dihydropyrazin-2-yl, 1,2-Dihydropyrazin-2-yl,
 1,2-Dihydropyrazin-3-yl, 1,2-Dihydropyrazin-5-yl,
 1,2-Dihydropyrazin-6-yl, 1,4-Dihydropyrimidin-2-yl,
 1,4-Dihydropyrimidin-4-yl, 1,4-Dihydropyrimidin-5-yl,
 15 1,4-Dihydropyrimidin-6-yl, 3,4-Dihydropyrimidin-2-yl,
 3,4-Dihydropyrimidin-4-yl, 3,4-Dihydropyrimidin-5-yl,
 3,4-Dihydropyrimidin-6-yl, Pyridazin-3-yl, Pyridazin-4-yl,
 Pyrimidin-2-yl, Pyrimidin-4-yl, Pyrimidin-5-yl, Pyrazin-2-yl,
 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl, 1,2,4-Triazin-5-yl,
 20 1,2,4-Triazin-6-yl oder 1,2,4,5-Tetra-zin-3-yl;

N-gebundene 5-gliedrige Ringe wie:

- Tetrahydropyrrol-1-yl, 2,3-Dihydro-1H-pyrrol-1-yl,
 25 2,5-Dihydro-1H-pyrrol-1-yl, Pyrrol-1-yl,
 Tetrahydropyrazol-1-yl, Tetrahydroisoxazol-2-yl,
 Tetrahydroisothiazol-2-yl, Tetrahydroimidazol-1-yl,
 Tetrahydrooxazol-3-yl, Tetrahydrothiazol-3-yl,
 4,5-Dihydro-1H-pyrazol-1-yl, 2,5-Dihydro-1H-pyrazol-1-yl,
 30 2,3-Dihydro-1H-pyrazol-1-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-2-yl,
 2,3-Dihydroisoxazol-2-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-2-yl,
 2,3-Dihydroisoxazol-2-yl, 4,5-Dihydro-1H-imidazol-1-yl,
 2,5-Dihydro-1H-imidazol-1-yl, 2,3-Dihydro-1H-imidazol-1-yl,
 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrothiazol-3-yl,
 35 Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, 1,2,4- Δ^4 -Oxadiazolin-2-yl,
 1,2,4- Δ^2 -Oxadiazolin-4-yl, 1,2,4- Δ^3 -Oxadiazolin-2-yl,
 1,3,4- Δ^2 -Oxadiazolin-4-yl, 1,2,4- Δ^5 -Thiadiazolin-2-yl,
 1,2,4- Δ^3 -Thiadiazolin-2-yl, 1,2,4- Δ^2 -Thiadiazolin-4-yl,
 1,3,4- Δ^2 -Thiadiazolin-4-yl, 1,2,3- Δ^2 -Triazol-1-yl,
 40 1,2,4- Δ^2 -Triazol-1-yl, 1,2,4- Δ^2 -Triazol-4-yl,
 1,2,4- Δ^3 -Triazol-1-yl, 1,2,4- Δ^1 -Triazol-4-yl,
 1,2,3-Triazol-1-yl, 1,2,4-Triazol-1-yl, Tetrazol-1-yl;

N-gebundene 6-gliedrige Ringe wie:

45

35

- Piperidin-1-yl, 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-1-yl,
 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-1-yl, 1,4-Dihydropyridin-1-yl,
 1,2-Dihydropyridin-1-yl, Hexahydropyrimidin-1-yl,
 Hexahydropyrazin-1-yl, Hexahydropyridazin-1-yl,
 5 Tetrahydro-1,3-oxazin-3-yl, Tetrahydro-1,3-thiazin-3-yl,
 Tetrahydro-1,4-thiazin-4-yl, Tetrahydro-1,4-oxazin-4-yl
 (Morpholinyl), Tetrahydro-1,2-oxazin-2-yl,
 2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-2-yl,
 2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-2-yl,
 10 2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-2-yl,
 2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-2-yl,
 2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-2-yl,
 2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-2-yl,
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-1-yl,
 15 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-2-yl,
 1,2,3,6-Tetrahydropyridazin-1-yl,
 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-3-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyrazin-1-yl,
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-1-yl,
 20 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-3-yl,
 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-4-yl, 2H-1,2-Oxazin-2-yl,
 2H-1,2-Thiazin-2-yl, 4H-1,4-Oxazin-4-yl, 4H-1,4-Thiazin-4-yl,
 1,4-Dihydropyridazin-1-yl, 1,4-Dihydropyrazin-1-yl,
 1,2-Dihydropyrazin-1-yl, 1,4-Dihydropyrimidin-1-yl oder
 25 3,4-Dihydropyrimidin-3-yl;

sowie N-gebundene cyclische Imide wie:

- Phthalsäureimid, Tetrahydrophthalsäureimid, Succinimid,
 30 Maleinimid, Glutarimid, 5-Oxo-triazolin-1-yl,
 5-Oxo-1,3,4-oxadiazolin-4-yl oder
 2,4-Dioxo-(1H,3H)-pyrimidin-3-yl;

- wobei mit einem ankondensierten Phenylring oder mit einem
 35 C₃-C₆-Carbocyclus oder einem weiteren 5- bis 6-gliedrigen
 Heterocyclus ein bicyclisches Ringsystem ausgebildet werden
 kann,

- wobei gegebenenfalls der Schwefel der genannten Heterocyclen
 40 zu S=O oder S(=O)₂ oxidiert sein kann

- und wobei mit einem ankondensierten Phenylring oder mit einem
 C₃-C₆-Carbocyclus oder mit einem weiteren 5- bis 6-gliedrigen
 Heterocyclus ein bicyclisches Ringsystem ausgebildet werden
 45 kann.

36

- Alle Phenylringe bzw. Heterocyclylreste sowie alle Phenylkomponenten in Phenoxy, Phenylalkyl, Phenylcarbonylalkyl, Phenylcarbonyl, Phenylalkenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl, Phenylthiocarbonyl, Phenylaminocarbonyl und
- 5 N-Alkyl-N-phenylaminocarbonyl, Phenylsulfonyl oder Phenoxy sulfonyl bzw. Heterocyclylkomponenten in Heterocyclyl oxy, Heterocyclylalkyl, Heterocyclylcarbonylalkyl, Heterocyclylcarbonyl, Heterocyclyl oxythiocarbonyl, Heterocyclylalkenylcarbonyl, Heterocyclyl oxy carbonyl,
- 10 Heterocyclylaminocarbonyl, N-Alkyl-N-heterocyclylaminocarbonyl, Heterocyclylsulfonyl oder Heterocyclyl oxy sulfonyl sind, soweit nicht anders angegeben, vorzugsweise unsubstituiert oder tragen ein, zwei oder drei Halogenatome und/oder eine Nitrogruppe, einen Cyanorest und/oder einen oder zwei Methyl-, Trifluormethyl-,
- 15 Methoxy- oder Trifluormethoxy substituenten.

Im Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I als Herbizide haben die Variablen X, Y, R¹ bis R¹⁶ vorzugsweise folgende Bedeutungen, und zwar jeweils für sich

20 alleine oder in Kombination:

- R¹ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkyloxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
- 25 C₁-C₆-Alkoxyalkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl-C₁-C₆-alkyl, besonders bevorzugt Methyl, Chlor, Methoxy, Methylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Brommethyl, Methoxymethyl, Methylsulfonylmethyl;
- 30 R² Wasserstoff, Halogen, z.B. Chlor oder Brom, C₁-C₆-Alkyl, z.B. Methyl;
- X C-R³ mit den für R³ zuvor genannten Bedeutungen oder N;
- 35 Y S, SO₂ oder N-R⁴ mit den für R⁴ zuvor genannten Bedeutungen;
- Hex Rest der allgemeinen Formel IIa, worin R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³ und R¹⁴ die zuvor genannten Bedeutungen
- 40 haben.

Bevorzugt sind insbesondere Verbindungen der Formel I, worin Y

45 für O, S, SO₂ oder N-R⁴ und X für C-R³ stehen. Bevorzugt sind auch

37

Verbindungen der Formel I, worin X für N und Y für S oder N-R⁴ stehen.

Bevorzugt haben R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³ und R¹⁴ die folgenden Bedeutungen:

- R⁸ Hydroxy, Halogen, Mercapto, OR¹⁵, SR¹⁵, SO₂R¹⁶, OSO₂R¹⁶, NR¹⁹R²⁰, ONR¹⁹R²⁰ oder N-gebundenes Heterocyclyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; insbesondere Hydroxy, OR¹⁵, SR¹⁵, N(OR¹⁹)R²⁰; besonders bevorzugt Hydroxy, C₁-C₄-Alkyloxy, Di-C₁-C₄-Alkylamino, N-C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkylamino, C₁-C₄-Alkylthio, Phenylthio, O-CH₂-Phenyl, Phenylcarbonyloxy, 2-, 3- oder 4-Fluorphenylcarbonyloxy, C₁-C₄-Sulfonyloxy, Phenylsulfonyloxy und 2-, 3- oder 4-Methylphenylsulfonyloxy;
- R⁹, R¹³ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, wie Methyl, Ethyl oder Propyl; bevorzugt Wasserstoff oder Methyl;
- R¹⁰, R¹², R¹⁴ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, wie Methyl, Ethyl oder Propyl; bevorzugt Wasserstoff oder Methyl;
- R¹¹ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, Di-(C₁-C₆-alkoxy)-methyl, (C₁-C₆-Alkoxy)-(C₁-C₆-alkylthio)-methyl, Di-(C₁-C₆-alkylthio)methyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;
- 1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl oder 1,3-Dithian-2-yl, wobei die sechs letztgenannten Reste durch einen, zwei oder drei C₁-C₄-Alkylreste substituiert sein können;
- bevorzugt Wasserstoff, Hydroxy oder C₁-C₄-Alkyl, wie Methyl, Ethyl oder Propyl;
- oder

38

R¹⁰ und R¹² oder R¹² und R¹⁴ bilden gemeinsam eine π -Bindung oder eine C₃-C₅-Alkylkette, die einen bis drei Reste aus folgender Gruppe tragen kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, aus;

5

oder

R¹⁰ und R¹⁴ oder R⁹ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₁-C₄-Alkylkette, die eine bis drei Reste aus folgender Gruppe tragen kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, aus;

10

oder

15 R¹¹ und R¹² bilden gemeinsam eine -O-(CH₂)_p-O-, -O-(CH₂)_p-S- oder -S-(CH₂)_p-S-Kette, die durch einen bis drei Reste aus folgender Gruppe substituiert sein kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl; bevorzugt bilden R²⁰ und R²¹ gemeinsam eine -O-(CH₂)_p-O-,
20 -O-(CH₂)_p-S- oder -S-(CH₂)_p-S-Kette, die durch einen bis drei der Reste aus folgender Gruppen substituiert sein kann: C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;

oder

25

R¹¹ und R¹² bilden gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an dem sie gebunden sind, eine Carbonylgruppe aus. Die Variable p steht vorzugsweise für 2 oder 3 und die Variable q vorzugsweise für 2, 3 oder 4.

30

Bevorzugte Bedeutungen für R¹⁵ bis R²⁰ sind:

R¹⁵ C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl,
35 C₃-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkinyloxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthiocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkinylaminocarbonyl, N,N-Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- oder Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/
45

39

oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-
amino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Hydroxy-
carbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-Alkyl)amino-
carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy oder C₃-C₆-Cycloalkyl;

Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
Phenylcarbonyl, Phenoxycarbonyl, Phenoxythiocarbonyl,
Phenyl-C₂-C₆-alkenylcarbonyl, Heterocyclyl, Heterocy-
cyl-C₁-C₆-alkyl, Heterocyclylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Hete-
rocyclylcarbonyl, Heterocycliloxycarbonyl, Heterocyclilo-
xythiocarbonyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkenylcarbonyl,
wobei der Phenyl- oder der Heterocyclyl-Rest der 14
letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig
halogeniert sein kann und/oder einen bis drei der folgen-
den Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl,
C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

bevorzugt C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl,
C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkyl-
aminocarbonyl oder N,N-Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, wo-
bei die genannten Alkyl- oder Alkoxyreste partiell oder
vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis
drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano,
C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
Phenylcarbonyl, Phenoxycarbonyl, Heterocyclyl-, Heterocy-
cyl-C₁-C₆-alkyl, Heterocyclylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Hete-
rocyclylcarbonyl oder Heterocycliloxycarbonyl, wobei der
Phenyl- oder der Heterocyclyl-Rest der 10 letztgenannten
Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein
kann und/oder einen bis drei der folgenden Reste tragen
kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl, wobei
die drei genannten Reste partiell oder vollständig halo-
geniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden
Gruppen tragen können: Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-
thio, C₁-C₄-Alkylcarbonyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Heterocyclyl oder Heterocy-
cyl-C₁-C₄-alkyl, wobei der Phenyl- oder der Heterocy-
cylrest der vier letztgenannten Substituenten partiell
oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen bis
drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano,

40

C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy,
C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

5 R¹⁷, R¹⁸ Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenoxy, wobei die drei letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen bis drei der folgenden Reste tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder
10 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

15 R¹⁹ C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy oder Di-(C₁-C₆-alkyl)amino, wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- oder Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen bis drei der folgenden Reste tragen können: Cyano, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl;

20 Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylcarbonyl, Heterocyclyl, Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl oder Heterocyclylcarbonyl, wobei der Phenyl- oder Heterocyclyl-Rest der sechs letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

30 R²⁰ C₁-C₆-Alkyl oder C₃-C₆-Alkenyl;

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für C-R³ steht und

35 R³ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,

40 Phenyl, oder Pyridyl, wobei die zwei letztgenannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei, insbesondere einen der folgenden Reste: Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, und C₁-C₄-Halogenalkoxy, tragen können;

45 oder

41

COOR⁵ mit den für R⁵ zuvor genannten Bedeutungen steht. Hierin steht R⁵ insbesondere für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl und besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, 2-Butyl, iso-Butyl und tert.-Butyl.

Hierunter bevorzugt sind auch Verbindungen der Formel I mit X = C-R³, worin R³ Cyclopropyl oder Phenoxy, das wie vorstehend für Phenyl angegeben substituiert sein kann, bedeutet.

10

Beispiele für bevorzugte Reste R³ sind Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Rhodano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, 2-Butyl, Isobutyl, tert-Butyl, Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl,

15 Trifluormethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxy, Ethoxy, 1-Propoxy, 2-Propoxy, 1-Butoxy, 2-Butoxy, 2-Methylprop-1-oxy, tert-Butyloxy, Difluormethyloxy, Trifluormethyloxy, 2,2,2-Trifluorethyl-1-oxy, (Methoxy)methyloxy, Methylsulfanyl, Ethylsulfanyl, n-Propylsulfanyl,

20 Isopropylsulfanyl, 1-Butylsulfanyl, 2-Butylsulfanyl, 2-Methylprop-1-ylsulfanyl, tert-Butylsulfanyl, Fluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, 2,2,2-Trifluorethyl-1-sulfanyl, 2-(Methylcarbonyl)ethyl, Phenyl, Phenoxy, 2-, 3- oder 4-Fluorphenyl, 2-, 3- oder 4-Chlorphenyl,

25 2-, 3- oder 4-Hydroxyphenyl, 2-, 3- oder 4-Methoxyphenyl, 2-, 3- oder 4-(Trifluormethoxy)phenyl, 2-, 3- oder 4-(Difluormethoxy)phenyl, 2-, 3- oder 4-(Trifluormethyl)phenyl, 2-, 3- oder 4-Tolyl, 2-, 3- oder 4-Fluorphenoxy, 2-, 3- oder 4-Methoxyphenoxy, 2-, 3- oder 4-Trifluormethylphenoxy, 2-, 3-

30 oder 4-Chlorphenoxy, 2-, 3- oder 4-Pyridinyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl und Phenoxycarbonyl.

Ganz besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I mit X = C-R³ sind solche Verbindungen, worin R³ für Wasserstoff, Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, insbesondere Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl und 2,2,2-Trifluorethyl, oder für Phenyl steht, wobei Phenyl einen, zwei oder drei und insbesondere einen Substituenten, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl, insbesondere Methyl, Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, C₁-C₄-Alkoxy, insbesondere Methoxy, oder Halogenalkoxy, insbesondere Trifluormethoxy, tragen kann.

Unter den vorstehend genannten Cyclohexenon-Derivaten der allgemeinen Formel I sind solche Verbindungen besonders bevorzugt, die sich von der Benzothiazol-5-carbonsäure ableiten, also Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für einen Rest C-R³ steht

42

und Y ausgewählt ist unter S, SO, und SO₂. Unter den Cyclohexenon-Derivaten des Benzothiazols sind wiederum solche bevorzugt, worin R³ eine der zuvor als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweist. Insbesondere steht Y für S oder SO₂.

5

Erfindungsgemäß bevorzugt sind auch solche Cyclohexenon-Derivate, die sich von der Benzoxazol-5-carbonsäure ableiten, d.h. Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für eine Gruppe C-R³ mit den zuvor für R³ angegebenen Bedeutungen und Y für ein Sauerstoffatom stehen. Hierunter sind wiederum solche Verbindungen bevorzugt, worin R³ die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen aufweist.

Ebenfalls bevorzugt sind Cyclohexenon-Derivate der allgemeinen Formel I, die sich von der Benzimidazol-5-carbonsäure ableiten, also Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für C-R³ mit den für R³ zuvor genannten Bedeutungen und Y für eine Gruppe N-R⁴ mit den zuvor für R⁴ genannten Bedeutungen stehen. Hierunter sind solche Benzimidazolderivate der allgemeinen Formel I bevorzugt, worin R³ die zuvor als für R³ bevorzugt genannten Bedeutungen aufweist. Ferner sind Benzimidazol-Derivate der allgemeinen Formel I bevorzugt, worin R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl, insbesondere für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl.

25

Erfindungsgemäß bevorzugt sind auch Cyclohexenon-Derivate der Benzotriazol-5-carbonsäure, also Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für Stickstoff und Y für eine Gruppe N-R⁴ mit den zuvor für R⁴ angegebenen Bedeutungen steht. Hierunter sind wiederum solche Verbindungen bevorzugt, worin R⁴ die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen aufweist.

Erfindungsgemäß bevorzugt sind auch Cyclohexenon-Derivate der Benzothiadiazol-5-carbonsäure, also Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für N und Y für S steht. Ebenfalls bevorzugt sind Pyrazolderivate der Benzoisothiadiazolcarbonsäure, also Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X-Y für S=N steht und X für S steht.

40 Besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I, worin

R⁸ für Hydroxy steht.

45

43

Ebenso besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I, worin

5 R^8 für Halogen, OR^{15} , SR^{15} , SO_2R^{16} , OSO_2R^{16} , $NR^{19}R^{20}$, $N(OR^{19})R^{20}$ oder N-gebundenes Heterocyclyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy; steht.

10

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I, worin die Variablen in Formel IIa oder IIb die folgenden Bedeutungen haben:

15 R^9 , R^{13} Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl;

R^{10} , R^{12} , R^{14} Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl;

20 R^{11} Wasserstoff, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, insbesondere C_1 - C_4 -Alkyl, Di- $(C_1$ - C_6 -alkoxy)-methyl, $(C_1$ - C_6 -Alkoxy)- $(C_1$ - C_6 -alkylthio)-methyl, Di- $(C_1$ - C_6 -alkylthio)-methyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl;

25 insbesondere Wasserstoff, Hydroxy oder C_1 - C_6 -Alkyl;

oder

30 R^9 und R^{13} oder R^{10} und R^{14} bilden gemeinsam eine C_1 - C_4 -Alkylkette, die einen bis drei Reste aus folgender Gruppe tragen kann: Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl;

insbesondere bilden R^{10} und R^{14} gemeinsam eine Methylen- oder eine Ethylenbrücke aus, die einen oder zwei Reste aus folgender Gruppe

35 tragen kann: Halogen, C_1 - C_2 -Alkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl;

oder

40 R^{11} und R^{12} bilden gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an dem sie gebunden sind, eine Carbonylgruppe aus.

Ganz außerordentlich bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, worin

45 R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} und R^{14} unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl stehen,

44

R¹¹ auch für Hydroxy, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halogenalkoxy oder Halogenalkylthio stehen kann,

5 R¹¹ und R¹² zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind auch eine Carbonylgruppe, einen 1,3-Dioxolan-, 1,3-Dithiolan-, 1,3-Oxothiolan-, 1,3-Oxothian-, 1,3-Dithiolan- oder einen 1,3-Dithian-Ring bedeuten können, wobei die 2-Position der sechs genannten Ringe mit dem C-Atom identisch ist, an das R¹¹ und R¹² gebunden sind,

10

R⁹ und R¹³ oder R¹⁰ und R¹⁴ auch eine C₁-C₄-Alkylkette bedeuten können,

15 R¹⁰ und R¹² oder R¹² und R¹³ gemeinsam eine π -Bindung ausbilden können.

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I, worin

20

R⁹, R¹³ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

R¹⁰, R¹², R¹⁴ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

25 R¹¹

Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, Di-(C₁-C₆-alkoxy)-methyl, (C₁-C₆-Alkoxy)-(C₁-C₆-alkylthio)-methyl, Di-(C₁-C₆-alkylthio)methyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;

30

insbesondere Wasserstoff, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkyl; bedeuten,

wobei

35 R¹¹ und R¹² auch gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an den sie gebunden sind, eine Carbonylgruppe ausbilden können.

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen worin Hex für einen Rest der Formel IIa steht.

40

45

Tabelle A: Besonders bevorzugte Kombinationen von R¹, R² und R³

	R ³	R ¹	R ²
5	1	H	CH ₃
	2	F	CH ₃
	3	Cl	CH ₃
	4	Br	CH ₃
10	5	OH	CH ₃
	6	SH	CH ₃
	7	NH ₂	CH ₃
	8	CN	CH ₃
15	9	NO ₂	CH ₃
	10	SCN	CH ₃
	11	NH-NH ₂	CH ₃
	12	CH ₃	CH ₃
20	13	C ₂ H ₅	CH ₃
	14	n-C ₃ H ₇	CH ₃
	15	i-C ₃ H ₇	CH ₃
	16	n-C ₄ H ₉	CH ₃
25	17	s-C ₄ H ₉	CH ₃
	18	i-C ₄ H ₉	CH ₃
	19	t-C ₄ H ₉	CH ₃
	20	CH ₂ Cl	CH ₃
30	21	CHCl ₂	CH ₃
	22	CCl ₃	CH ₃
	23	CH ₂ F	CH ₃
	24	CHF ₂	CH ₃
35	25	CF ₃	CH ₃
	26	CH ₂ CF ₃	CH ₃
	27	CH ₂ OCH ₃	CH ₃
	28	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃
40	29	CH ₂ NH ₂	CH ₃
	30	OCH ₃	CH ₃
	31	OC ₂ H ₅	CH ₃
	32	O-n-C ₃ H ₇	CH ₃
45	33	O-i-C ₃ H ₇	CH ₃
	34	O-n-C ₄ H ₉	CH ₃
	35	O-s-C ₄ H ₉	CH ₃
	36	O-i-C ₄ H ₉	CH ₃

46

	R ³	R ¹	R ²
	O-t-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
	OCHF ₂	CH ₃	CH ₃
5	OCF ₃	CH ₃	CH ₃
	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃
	OCH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	SCH ₃	CH ₃	CH ₃
10	SC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
	S-n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃
	S-i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃
	S-n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
	S-s-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
15	S-i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
	S-t-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
	SCHF ₂	CH ₃	CH ₃
	SCF ₃	CH ₃	CH ₃
20	SCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃
	SCH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	NHCH ₃	CH ₃	CH ₃
	NHC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
25	NH-Phenyl	CH ₃	CH ₃
	N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃
	N(CH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃
	N(Phenyl) ₂	CH ₃	CH ₃
30	(CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	CH ₃
	Phenyl	CH ₃	CH ₃
	2-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃
	3-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃
	4-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃
35	2-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃
	3-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃
	4-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃
	2-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃
40	3-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃
	4-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃
	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
45	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃

47

	R ³	R ¹	R ²
	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
5	3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
10	4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
15	3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃
	2-Pyridyl	CH ₃	CH ₃
	3-Pyridyl	CH ₃	CH ₃
20	4-Pyridyl	CH ₃	CH ₃
	3'-CH ₃ -2-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	4'-CH ₃ -2-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	5'-CH ₃ -2-pyridyl	CH ₃	CH ₃
25	6'-CH ₃ -2-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	2'-CH ₃ -3-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	4'-CH ₃ -3-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	5'-CH ₃ -3-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	6'-CH ₃ -3-pyridyl	CH ₃	CH ₃
30	2'-CH ₃ -4-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	3'-CH ₃ -4-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	3'-Cl-2-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	4'-Cl-2-pyridyl	CH ₃	CH ₃
35	5'-Cl-2-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	6'-Cl-2-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	2'-Cl-3-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	4'-Cl-3-pyridyl	CH ₃	CH ₃
40	5'-Cl-3-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	6'-Cl-3-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	2'-Cl-4-pyridyl	CH ₃	CH ₃
	3'-Cl-4-pyridyl	CH ₃	CH ₃
45	Cyclohexylamino	CH ₃	CH ₃
	Cyclopentylamino	CH ₃	CH ₃
	Morpholino	CH ₃	CH ₃

48

	R ³	R ¹	R ²	
	115	CO ₂ H	CH ₃	CH ₃
	116	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃
5	117	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
	118	CO ₂ -n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃
	119	CO ₂ -i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃
	120	CO ₂ -n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
10	121	CO ₂ -s-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
	122	CO ₂ -i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
	123	CO ₂ -t-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃
	124	CO ₂ -Ph	CH ₃	CH ₃
	125	CO ₂ -3-Pyridyl	CH ₃	CH ₃
15	126	CONHCH ₃	CH ₃	CH ₃
	127	CONHC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
	128	CONHPh	CH ₃	CH ₃
	129	CON(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃
20	130	CON(CH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃
	131	CON(Phenyl) ₂	CH ₃	CH ₃
	132	H	OCH ₃	CH ₃
	133	F	OCH ₃	CH ₃
25	134	Cl	OCH ₃	CH ₃
	135	Br	OCH ₃	CH ₃
	136	OH	OCH ₃	CH ₃
	137	SH	OCH ₃	CH ₃
	138	NH ₂	OCH ₃	CH ₃
30	139	CN	OCH ₃	CH ₃
	140	NO ₂	OCH ₃	CH ₃
	141	SCN	OCH ₃	CH ₃
	142	NH-NH ₂	OCH ₃	CH ₃
35	143	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
	144	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃
	145	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃
	146	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃
40	147	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	148	s-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	149	i-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	150	t-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
45	151	CH ₂ Cl	OCH ₃	CH ₃
	152	CHCl ₂	OCH ₃	CH ₃
	153	CCl ₃	OCH ₃	CH ₃

49

	R ³	R ¹	R ²
	CH ₂ F	OCH ₃	CH ₃
	CHF ₂	OCH ₃	CH ₃
5	CF ₃	OCH ₃	CH ₃
	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃
10	CH ₂ NH ₂	OCH ₃	CH ₃
	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃
	O-n-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃
	O-i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃
15	O-n-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	O-s-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	O-i-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	O-t-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
20	OCHF ₂	OCH ₃	CH ₃
	OCF ₃	OCH ₃	CH ₃
	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH ₃
	OCH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
25	SCH ₃	OCH ₃	CH ₃
	SC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃
	S-n-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃
	S-i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃
	S-n-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
30	S-s-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	S-i-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	S-t-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	SCHF ₂	OCH ₃	CH ₃
35	SCF ₃	OCH ₃	CH ₃
	SCH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH ₃
	SCH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
	NHCH ₃	OCH ₃	CH ₃
40	NHC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃
	NHPhenyl	OCH ₃	CH ₃
	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₃
	N(CH ₂ CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₃
	N(Phenyl) ₂	OCH ₃	CH ₃
45	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	CH ₃
	Phenyl	OCH ₃	CH ₃

50

	R ³	R ¹	R ²
	2-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	3-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
5	4-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
10	2-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	3-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	4-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
15	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
20	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
25	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
30	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃
	2-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃
35	3-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	4-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	3'-CH ₃ -2-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	4'-CH ₃ -2-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
40	5'-CH ₃ -2-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	6'-CH ₃ -2-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	2'-CH ₃ -3-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	4'-CH ₃ -3-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	5'-CH ₃ -3-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
45	6'-CH ₃ -3-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	2'-CH ₃ -4-pyridyl	OCH ₃	CH ₃

51

	R ³	R ¹	R ²	
	232	3'-CH ₃ -4-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	233	3'-Cl-2-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
5	234	4'-Cl-2-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	235	5'-Cl-2-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	236	6'-Cl-2-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	237	2'-Cl-3-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
10	238	4'-Cl-3-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	239	5'-Cl-3-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	240	6'-Cl-3-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	241	2'-Cl-4-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	242	3'-Cl-4-pyridyl	OCH ₃	CH ₃
15	243	Cyclohexylamino	OCH ₃	CH ₃
	244	Cyclopentylamino	OCH ₃	CH ₃
	245	Morpholino	OCH ₃	CH ₃
	246	CO ₂ H	OCH ₃	CH ₃
20	247	CO ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃
	248	CO ₂ C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃
	249	CO ₂ -n-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃
	250	CO ₂ -i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃
25	251	CO ₂ -n-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	252	CO ₂ -s-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	253	CO ₂ -i-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	254	CO ₂ -t-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃
	255	CO ₂ -Ph	OCH ₃	CH ₃
30	256	CO ₂ -3-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃
	257	CONHCH ₃	OCH ₃	CH ₃
	258	CONHC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃
	259	CONHPhenyl	OCH ₃	CH ₃
35	260	CON(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₃
	261	CON(CH ₂ CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₃
	262	CON(Phenyl) ₂	OCH ₃	CH ₃
	263	H	Cl	CH ₃
40	264	F	Cl	CH ₃
	265	Cl	Cl	CH ₃
	266	Br	Cl	CH ₃
	267	OH	Cl	CH ₃
45	268	SH	Cl	CH ₃
	269	NH ₂	Cl	CH ₃
	270	CN	Cl	CH ₃

52

	R ³	R ¹	R ²	
	271	NO ₂	Cl	CH ₃
	272	SCN	Cl	CH ₃
5	273	NH-NH ₂	Cl	CH ₃
	274	CH ₃	Cl	CH ₃
	275	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃
	276	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃
	277	i-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃
10	278	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	279	s-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	280	i-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	281	t-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
15	282	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
	283	CHCl ₂	Cl	CH ₃
	284	CCl ₃	Cl	CH ₃
	285	CH ₂ F	Cl	CH ₃
20	286	CHF ₂	Cl	CH ₃
	287	CF ₃	Cl	CH ₃
	288	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₃
	289	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃
25	290	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃
	291	CH ₂ NH ₂	Cl	CH ₃
	292	OCH ₃	Cl	CH ₃
	293	OC ₂ H ₅	Cl	CH ₃
	294	O-n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃
30	295	O-i-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃
	296	O-n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	297	O-s-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	298	O-i-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
35	299	O-t-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	300	OCHF ₂	Cl	CH ₃
	301	OCF ₃	Cl	CH ₃
	302	OCH ₂ CF ₃	Cl	CH ₃
40	303	OCH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃
	304	SCH ₃	Cl	CH ₃
	305	SC ₂ H ₅	Cl	CH ₃
	306	S-n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃
	307	S-i-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃
45	308	S-n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	309	S-s-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃

53

	R ³	R ¹	R ²	
	310	S-i-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	311	S-t-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
5	312	SCHF ₂	Cl	CH ₃
	313	SCF ₃	Cl	CH ₃
	314	SCH ₂ CF ₃	Cl	CH ₃
	315	SCH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃
10	316	NHCH ₃	Cl	CH ₃
	317	NHC ₂ H ₅	Cl	CH ₃
	318	NH-Phenyl	Cl	CH ₃
	319	N(CH ₃) ₂	Cl	CH ₃
	320	N(CH ₂ CH ₃) ₂	Cl	CH ₃
15	321	N(Phenyl) ₂	Cl	CH ₃
	322	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	CH ₃
	323	Phenyl	Cl	CH ₃
	324	2-F-Phenyl	Cl	CH ₃
20	325	3-F-Phenyl	Cl	CH ₃
	362	4-F-Phenyl	Cl	CH ₃
	327	2-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃
	328	3-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃
25	329	4-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃
	330	2-OH-Phenyl	Cl	CH ₃
	331	3-OH-Phenyl	Cl	CH ₃
	332	4-OH-Phenyl	Cl	CH ₃
	333	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
30	334	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	335	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	336	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	337	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
35	338	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	339	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃
	340	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃
	341	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃
40	342	2-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	343	3-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	344	4-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	345	2-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
45	346	3-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	347	4-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃
	348	2-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃

54

	R ³	R ¹	R ²
	3-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃
	4-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃
5	2-Pyridyl	Cl	CH ₃
	3-Pyridyl	Cl	CH ₃
	4-Pyridyl	Cl	CH ₃
	3'-CH ₃ -2-pyridyl	Cl	CH ₃
10	4'-CH ₃ -2-pyridyl	Cl	CH ₃
	5'-CH ₃ -2-pyridyl	Cl	CH ₃
	6'-CH ₃ -2-pyridyl	Cl	CH ₃
	2'-CH ₃ -3-pyridyl	Cl	CH ₃
	4'-CH ₃ -3-pyridyl	Cl	CH ₃
15	5'-CH ₃ -3-pyridyl	Cl	CH ₃
	6'-CH ₃ -3-pyridyl	Cl	CH ₃
	2'-CH ₃ -4-pyridyl	Cl	CH ₃
	3'-CH ₃ -4-pyridyl	Cl	CH ₃
20	3'-Cl-2-pyridyl	Cl	CH ₃
	4'-Cl-2-pyridyl	Cl	CH ₃
	5'-Cl-2-pyridyl	Cl	CH ₃
	6'-Cl-2-pyridyl	Cl	CH ₃
25	2'-Cl-3-pyridyl	Cl	CH ₃
	4'-Cl-3-pyridyl	Cl	CH ₃
	5'-Cl-3-pyridyl	Cl	CH ₃
	6'-Cl-3-pyridyl	Cl	CH ₃
30	2'-Cl-4-pyridyl	Cl	CH ₃
	3'-Cl-4-pyridyl	Cl	CH ₃
	Cyclohexylamino	Cl	CH ₃
	Cyclopentylamino	Cl	CH ₃
	Morpholino	Cl	CH ₃
35	CO ₂ H	Cl	CH ₃
	CO ₂ CH ₃	Cl	CH ₃
	CO ₂ C ₂ H ₅	Cl	CH ₃
	CO ₂ -n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃
40	CO ₂ -i-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃
	CO ₂ -n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	CO ₂ -s-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	CO ₂ -i-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
45	CO ₂ -t-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃
	CO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃
	CO ₂ -3-Pyridyl	Cl	CH ₃

55

	R ³	R ¹	R ²	
	388	CONHCH ₃	Cl	CH ₃
	389	CONHC ₂ H ₅	Cl	CH ₃
5	390	CONH-Phenyl	Cl	CH ₃
	391	CON(CH ₃) ₂	Cl	CH ₃
	392	CON(CH ₂ CH ₃) ₂	Cl	CH ₃
	393	CON(Phenyl) ₂	Cl	CH ₃
10	394	H	CH ₃	H
	394	F	CH ₃	H
	396	Cl	CH ₃	H
	397	Br	CH ₃	H
	398	OH	CH ₃	H
15	399	SH	CH ₃	H
	400	NH ₂	CH ₃	H
	401	CN	CH ₃	H
	402	NO ₂	CH ₃	H
20	403	SCN	CH ₃	H
	404	NH-NH ₂	CH ₃	H
	405	CH ₃	CH ₃	H
	406	C ₂ H ₅	CH ₃	H
25	407	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H
	408	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
	409	n-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	410	s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	411	i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
30	412	t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	413	CH ₂ Cl	CH ₃	H
	414	CHCl ₂	CH ₃	H
	415	CCl ₃	CH ₃	H
35	416	CH ₂ F	CH ₃	H
	417	CHF ₂	CH ₃	H
	418	CF ₃	CH ₃	H
	419	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H
40	420	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H
	421	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H
	422	CH ₂ NH ₂	CH ₃	H
	423	OCH ₃	CH ₃	H
	424	OC ₂ H ₅	CH ₃	H
45	425	O-n-C ₃ H ₇	CH ₃	H
	462	O-i-C ₃ H ₇	CH ₃	H

56

	R ³	R ¹	R ²	
	427	O-n-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	428	O-s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
5	429	O-i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	430	O-t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	431	OCHF ₂	CH ₃	H
	432	OCF ₃	CH ₃	H
10	433	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	H
	434	OCH ₂ OCH ₃	CH ₃	H
	435	SCH ₃	CH ₃	H
	436	SC ₂ H ₅	CH ₃	H
	437	S-n-C ₃ H ₇	CH ₃	H
15	438	S-i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
	439	S-n-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	440	S-s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	441	S-i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
20	442	S-t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	443	SCHF ₂	CH ₃	H
	444	SCF ₃	CH ₃	H
	445	SCH ₂ CF ₃	CH ₃	H
25	446	SCH ₂ OCH ₃	CH ₃	H
	447	NHCH ₃	CH ₃	H
	448	NHC ₂ H ₅	CH ₃	H
	449	NH-Phenyl	CH ₃	H
	450	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H
30	451	N(CH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃	H
	452	N(Phenyl) ₂	CH ₃	H
	453	(CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	H
	454	Phenyl	CH ₃	H
35	455	2-F-Phenyl	CH ₃	H
	456	3-F-Phenyl	CH ₃	H
	457	4-F-Phenyl	CH ₃	H
	458	2-Cl-Phenyl	CH ₃	H
40	459	3-Cl-Phenyl	CH ₃	H
	460	4-Cl-Phenyl	CH ₃	H
	461	2-OH-Phenyl	CH ₃	H
	462	3-OH-Phenyl	CH ₃	H
	463	4-OH-Phenyl	CH ₃	H
45	464	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	465	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H

57

	R ³	R ¹	R ²
	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
5	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H
	3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H
10	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H
	2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H
15	3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H
	3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H
20	4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H
	2-Pyridyl	CH ₃	H
	3-Pyridyl	CH ₃	H
	4-Pyridyl	CH ₃	H
25	3'-CH ₃ -2-pyridyl	CH ₃	H
	4'-CH ₃ -2-pyridyl	CH ₃	H
	5'-CH ₃ -2-pyridyl	CH ₃	H
	6'-CH ₃ -2-pyridyl	CH ₃	H
	2'-CH ₃ -3-pyridyl	CH ₃	H
30	4'-CH ₃ -3-pyridyl	CH ₃	H
	5'-CH ₃ -3-pyridyl	CH ₃	H
	6'-CH ₃ -3-pyridyl	CH ₃	H
	2'-CH ₃ -4-pyridyl	CH ₃	H
35	3'-CH ₃ -4-pyridyl	CH ₃	H
	3'-Cl-2-pyridyl	CH ₃	H
	4'-Cl-2-pyridyl	CH ₃	H
	5'-Cl-2-pyridyl	CH ₃	H
40	6'-Cl-2-pyridyl	CH ₃	H
	2'-Cl-3-pyridyl	CH ₃	H
	4'-Cl-3-pyridyl	CH ₃	H
	5'-Cl-3-pyridyl	CH ₃	H
45	6'-Cl-3-pyridyl	CH ₃	H
	2'-Cl-4-pyridyl	CH ₃	H
	3'-Cl-4-pyridyl	CH ₃	H

58

	R ³	R ¹	R ²	
	505	Cyclohexylamino	CH ₃	H
	506	Cyclopentylamino	CH ₃	H
5	507	Morpholino	CH ₃	H
	508	CO ₂ H	CH ₃	H
	509	CO ₂ CH ₃	CH ₃	H
	510	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	H
10	511	CO ₂ -n-C ₃ H ₇	CH ₃	H
	512	CO ₂ -i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
	513	CO ₂ -n-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	514	CO ₂ -s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	515	CO ₂ -i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
15	516	CO ₂ -t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	517	CO ₂ -Ph	CH ₃	H
	518	CO ₂ -3-Pyridyl	CH ₃	H
	519	CONHCH ₃	CH ₃	H
20	520	CONHC ₂ H ₅	CH ₃	H
	521	CONH-Phenyl	CH ₃	H
	522	CON(CH ₃) ₂	CH ₃	H
	523	CON(CH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃	H
25	524	CON(Phenyl) ₂	CH ₃	H
	525	H	OCH ₃	H
	526	F	OCH ₃	H
	527	Cl	OCH ₃	H
	528	Br	OCH ₃	H
30	529	OH	OCH ₃	H
	530	SH	OCH ₃	H
	531	NH ₂	OCH ₃	H
	532	CN	OCH ₃	H
35	533	NO ₂	OCH ₃	H
	534	SCN	OCH ₃	H
	535	NH-NH ₂	OCH ₃	H
	536	CH ₃	OCH ₃	H
40	537	C ₂ H ₅	OCH ₃	H
	538	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	H
	539	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	H
	540	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	541	s-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
45	542	i-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	543	t-C ₄ H ₉	OCH ₃	H

59

	R ³	R ¹	R ²	
	544	CH ₂ Cl	OCH ₃	H
	545	CHCl ₂	OCH ₃	H
5	546	CCl ₃	OCH ₃	H
	547	CH ₂ F	OCH ₃	H
	548	CHF ₂	OCH ₃	H
	549	CF ₃	OCH ₃	H
10	550	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H
	551	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	H
	552	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	H
	553	CH ₂ NH ₂	OCH ₃	H
	554	OCH ₃	OCH ₃	H
15	555	OC ₂ H ₅	OCH ₃	H
	556	O-n-C ₃ H ₇	OCH ₃	H
	557	O-i-C ₃ H ₇	OCH ₃	H
	558	O-n-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
20	559	O-s-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	560	O-i-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	561	O-t-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	562	OCHF ₂	OCH ₃	H
25	563	OCF ₃	OCH ₃	H
	564	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	H
	565	OCH ₂ OCH ₃	OCH ₃	H
	566	SCH ₃	OCH ₃	H
	567	SC ₂ H ₅	OCH ₃	H
30	568	S-n-C ₃ H ₇	OCH ₃	H
	569	S-i-C ₃ H ₇	OCH ₃	H
	570	S-n-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	571	S-s-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
35	572	S-i-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	573	S-t-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	574	SCHF ₂	OCH ₃	H
	575	SCF ₃	OCH ₃	H
40	576	SCH ₂ CF ₃	OCH ₃	H
	577	SCH ₂ OCH ₃	OCH ₃	H
	578	NHCH ₃	OCH ₃	H
	579	NHC ₂ H ₅	OCH ₃	H
45	580	NHPh	OCH ₃	H
	581	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	H
	582	N(CH ₂ CH ₃) ₂	OCH ₃	H

60

	R ³	R ¹	R ²
	N(Phenyl) ₂	OCH ₃	H
	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	H
5	Phenyl	OCH ₃	H
	2-F-Phenyl	OCH ₃	H
	3-F-Phenyl	OCH ₃	H
	4-F-Phenyl	OCH ₃	H
10	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	H
	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	H
	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	H
	2-OH-Phenyl	OCH ₃	H
	3-OH-Phenyl	OCH ₃	H
15	4-OH-Phenyl	OCH ₃	H
	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
20	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H
25	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H
	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H
	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
30	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H
	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H
35	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H
	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H
	2-Pyridyl	OCH ₃	H
	3-Pyridyl	OCH ₃	H
40	4-Pyridyl	OCH ₃	H
	3'-CH ₃ -2-pyridyl	OCH ₃	H
	4'-CH ₃ -2-pyridyl	OCH ₃	H
	5'-CH ₃ -2-pyridyl	OCH ₃	H
	6'-CH ₃ -2-pyridyl	OCH ₃	H
45	2'-CH ₃ -3-pyridyl	OCH ₃	H
	4'-CH ₃ -3-pyridyl	OCH ₃	H

61

	R ³	R ¹	R ²
	5'-CH ₃ -3-pyridyl	OCH ₃	H
	6'-CH ₃ -3-pyridyl	OCH ₃	H
5	2'-CH ₃ -4-pyridyl	OCH ₃	H
	3'-CH ₃ -4-pyridyl	OCH ₃	H
	3'-Cl-2-pyridyl	OCH ₃	H
	4'-Cl-2-pyridyl	OCH ₃	H
10	5'-Cl-2-pyridyl	OCH ₃	H
	6'-Cl-2-pyridyl	OCH ₃	H
	2'-Cl-3-pyridyl	OCH ₃	H
	4'-Cl-3-pyridyl	OCH ₃	H
	5'-Cl-3-pyridyl	OCH ₃	H
15	6'-Cl-3-pyridyl	OCH ₃	H
	2'-Cl-4-pyridyl	OCH ₃	H
	3'-Cl-4-pyridyl	OCH ₃	H
	Cyclohexylamino	OCH ₃	H
20	Cyclopentylamino	OCH ₃	H
	Morpholino	OCH ₃	H
	CO ₂ H	OCH ₃	H
	CO ₂ CH ₃	OCH ₃	H
25	CO ₂ C ₂ H ₅	OCH ₃	H
	CO ₂ -n-C ₃ H ₇	OCH ₃	H
	CO ₂ -i-C ₃ H ₇	OCH ₃	H
	CO ₂ -n-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	CO ₂ -s-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
30	CO ₂ -i-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	CO ₂ -t-C ₄ H ₉	OCH ₃	H
	CO ₂ -Ph	OCH ₃	H
	CO ₂ -3-Pyridyl	OCH ₃	H
35	CONHCH ₃	OCH ₃	H
	CONHC ₂ H ₅	OCH ₃	H
	CONH-Phenyl	OCH ₃	H
	CON(CH ₃) ₂	OCH ₃	H
40	CON(CH ₂ CH ₃) ₂	OCH ₃	H
	CON(Phenyl) ₂	OCH ₃	H
	H	Cl	H
	F	Cl	H
45	Cl	Cl	H
	Br	Cl	H
	OH	Cl	H

62

	R ³	R ¹	R ²
	SH	Cl	H
	NH ₂	Cl	H
5	CN	Cl	H
	NO ₂	Cl	H
	SCN	Cl	H
	NH-NH ₂	Cl	H
10	CH ₃	Cl	H
	C ₂ H ₅	Cl	H
	n-C ₃ H ₇	Cl	H
	i-C ₃ H ₇	Cl	H
	n-C ₄ H ₉	Cl	H
15	s-C ₄ H ₉	Cl	H
	i-C ₄ H ₉	Cl	H
	t-C ₄ H ₉	Cl	H
	CH ₂ Cl	Cl	H
20	CHCl ₂	Cl	H
	CCl ₃	Cl	H
	CH ₂ F	Cl	H
	CHF ₂	Cl	H
25	CF ₃	Cl	H
	CH ₂ CF ₃	Cl	H
	CH ₂ OCH ₃	Cl	H
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	H
	CH ₂ NH ₂	Cl	H
30	OCH ₃	Cl	H
	OC ₂ H ₅	Cl	H
	O-n-C ₃ H ₇	Cl	H
	O-i-C ₃ H ₇	Cl	H
35	O-n-C ₄ H ₉	Cl	H
	O-s-C ₄ H ₉	Cl	H
	O-i-C ₄ H ₉	Cl	H
	O-t-C ₄ H ₉	Cl	H
40	OCHF ₂	Cl	H
	OCF ₃	Cl	H
	OCH ₂ CF ₃	Cl	H
	OCH ₂ OCH ₃	Cl	H
	SCH ₃	Cl	H
45	SC ₂ H ₅	Cl	H
	S-n-C ₃ H ₇	Cl	H

63

	R ³	R ¹	R ²	
	700	S-i-C ₃ H ₇	Cl	H
	701	S-n-C ₄ H ₉	Cl	H
5	702	S-s-C ₄ H ₉	Cl	H
	703	S-i-C ₄ H ₉	Cl	H
	704	S-t-C ₄ H ₉	Cl	H
	705	SCHF ₂	Cl	H
10	706	SCF ₃	Cl	H
	707	SCH ₂ CF ₃	Cl	H
	708	SCH ₂ OCH ₃	Cl	H
	709	NHCH ₃	Cl	H
15	710	NHC ₂ H ₅	Cl	H
	711	NHPh	Cl	H
	712	N(CH ₃) ₂	Cl	H
	713	N(CH ₂ CH ₃) ₂	Cl	H
	714	N(Phenyl) ₂	Cl	H
20	715	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	H
	716	Phenyl	Cl	H
	717	2-F-Phenyl	Cl	H
	718	3-F-Phenyl	Cl	H
25	719	4-F-Phenyl	Cl	H
	720	2-Cl-Phenyl	Cl	H
	721	3-Cl-Phenyl	Cl	H
	722	4-Cl-Phenyl	Cl	H
	723	2-OH-Phenyl	Cl	H
30	724	3-OH-Phenyl	Cl	H
	725	4-OH-Phenyl	Cl	H
	726	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H
	727	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H
35	728	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H
	729	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H
	730	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H
	731	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H
40	732	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H
	733	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H
	734	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H
	735	2-CF ₃ -Phenyl	Cl	H
45	736	3-CF ₃ -Phenyl	Cl	H
	737	4-CF ₃ -Phenyl	Cl	H
	738	2-CH ₃ -Phenyl	Cl	H

64

	R ³	R ¹	R ²
	3-CH ₃ -Phenyl	Cl	H
	4-CH ₃ -Phenyl	Cl	H
5	2-NO ₂ -Phenyl	Cl	H
	3-NO ₂ -Phenyl	Cl	H
	4-NO ₂ -Phenyl	Cl	H
	2-Pyridyl	Cl	H
10	3-Pyridyl	Cl	H
	4-Pyridyl	Cl	H
	3'-CH ₃ -2-pyridyl	Cl	H
	4'-CH ₃ -2-pyridyl	Cl	H
	5'-CH ₃ -2-pyridyl	Cl	H
15	6'-CH ₃ -2-pyridyl	Cl	H
	2'-CH ₃ -3-pyridyl	Cl	H
	4'-CH ₃ -3-pyridyl	Cl	H
	5'-CH ₃ -3-pyridyl	Cl	H
20	6'-CH ₃ -3-pyridyl	Cl	H
	2'-CH ₃ -4-pyridyl	Cl	H
	3'-CH ₃ -4-pyridyl	Cl	H
	3'-Cl-2-pyridyl	Cl	H
25	4'-Cl-2-pyridyl	Cl	H
	5'-Cl-2-pyridyl	Cl	H
	6'-Cl-2-pyridyl	Cl	H
	2'-Cl-3-pyridyl	Cl	H
30	4'-Cl-3-pyridyl	Cl	H
	5'-Cl-3-pyridyl	Cl	H
	6'-Cl-3-pyridyl	Cl	H
	2'-Cl-4-pyridyl	Cl	H
	3'-Cl-4-pyridyl	Cl	H
35	Cyclohexylamino	Cl	H
	Cyclopentylamino	Cl	H
	Morpholino	Cl	H
	CO ₂ H	Cl	H
40	CO ₂ CH ₃	Cl	H
	CO ₂ C ₂ H ₅	Cl	H
	CO ₂ -n-C ₃ H ₇	Cl	H
	CO ₂ -i-C ₃ H ₇	Cl	H
	CO ₂ -n-C ₄ H ₉	Cl	H
45	CO ₂ -s-C ₄ H ₉	Cl	H
	CO ₂ -i-C ₄ H ₉	Cl	H

65

	R ³	R ¹	R ²	
	778	CO ₂ -t-C ₄ H ₉	Cl	H
	779	CO ₂ -Phenyl	Cl	H
5	780	CO ₂ -3-Pyridyl	Cl	H
	781	CONHCH ₃	Cl	H
	782	CONHC ₂ H ₅	Cl	H
	783	CONH-Phenyl	Cl	H
10	784	CON(CH ₃) ₂	Cl	H
	785	CON(CH ₂ CH ₃) ₂	Cl	H
	786	CON(Phenyl) ₂	Cl	H
	787	2-Fluorphenoxy	CH ₃	CH ₃
	788	2-Fluorphenoxy	OCH ₃	CH ₃
15	789	2-Fluorphenoxy	Cl	CH ₃
	790	2-Fluorphenoxy	CH ₃	H
	791	2-Fluorphenoxy	OCH ₃	H
	792	2-Fluorphenoxy	Cl	H
20	793	Phenoxy	CH ₃	CH ₃
	794	Phenoxy	OCH ₃	CH ₃
	795	Phenoxy	Cl	CH ₃
	796	Phenoxy	CH ₃	H
	797	Phenoxy	OCH ₃	H
25	798	Phenoxy	Cl	H
	799	2-Methoxyphenoxy	CH ₃	CH ₃
	800	2-Methoxyphenoxy	OCH ₃	CH ₃
	801	2-Methoxyphenoxy	Cl	CH ₃
30	802	2-Methoxyphenoxy	CH ₃	H
	803	2-Methoxyphenoxy	OCH ₃	H
	804	2-Methoxyphenoxy	Cl	H
	805	Cyclopropyl	CH ₃	CH ₃
35	806	Cyclopropyl	OCH ₃	CH ₃
	807	Cyclopropyl	Cl	CH ₃
	808	Cyclopropyl	CH ₃	H
	809	Cyclopropyl	OCH ₃	H
40	810	Cyclopropyl	Cl	H

Hier und im folgenden bedeuten beispielsweise:

2-F-Phenyl = 2-Fluorphenyl

45 2-Cl-Phenyl = 2-Chlorphenyl

2-OH-Phenyl = 2-Hydroxyphenyl

2-OCH₃-Phenyl = 2-Methoxyphenyl

66

2-OCF₃-Phenyl = 2-Trifluormethoxyphenyl

2-OCHF₂-Phenyl = 2-Difluormethoxyphenyl

2-NO₂-Phenyl = 2-Nitrophenyl

3'-CH₃-2-pyridyl = 3'-Methylpyridin-2-yl

5

10

15

20

25

30

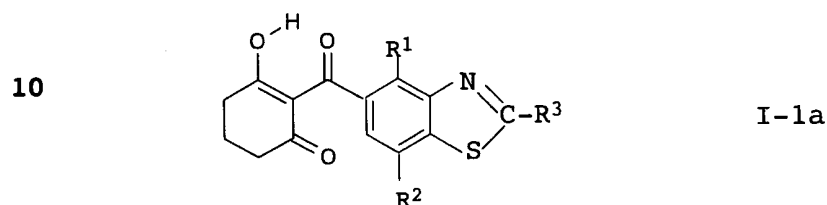
35

40

45

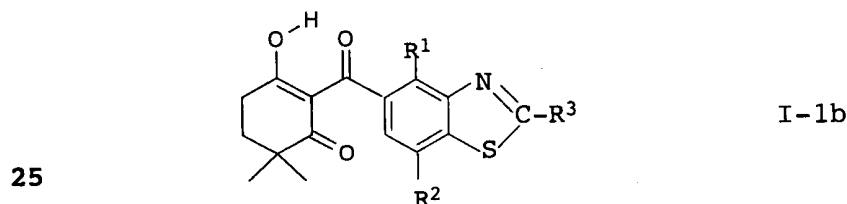
Beispiele für erfindungsgemäße besonders bevorzugte Benzothiazol-5-ylcarbonyl-Derivate von Cyclohexenonen (Verbindungen I-1 = Verbindungen I mit $X = C-R^3$ und $Y = S$) sind die in den Tabellen 1 bis 25 genannten Verbindungen.

- Tabelle 1: Verbindungen I-1a.1 bis I-1a.810



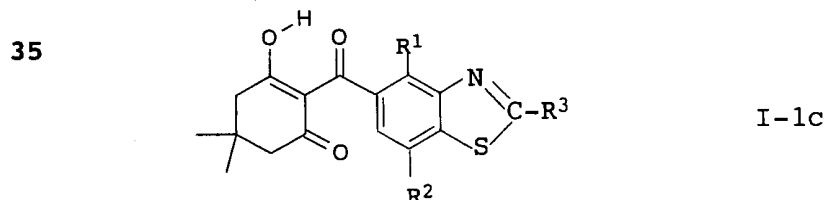
15 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1a, in der die Substituenten R_1 , R_2 und R_3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 2: Verbindungen I-1b.1 bis I-1b.810



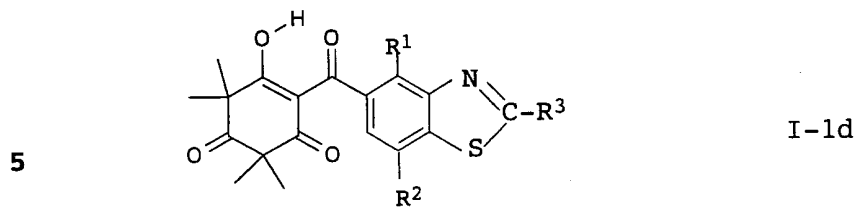
30 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1b, in der die Substituenten R_1 , R_2 und R_3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 3: Verbindungen I-1c.1 bis I-1c.810



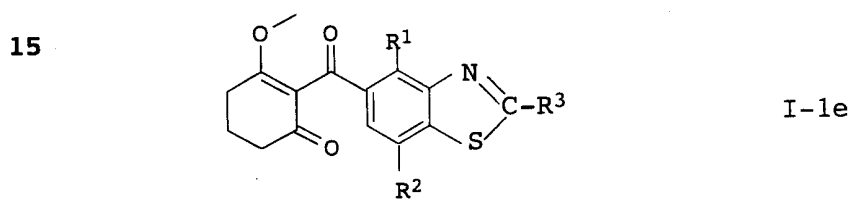
40 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1c, in der die Substituenten R_1 , R_2 und R_3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

45 - Tabelle 4: Verbindungen I-1d.1 bis I-1d.810



Verbindungen der allgemeinen Formel I-1b, in der die Substituen-
 10 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 5: Verbindungen I-1e.1 bis I-1e.810

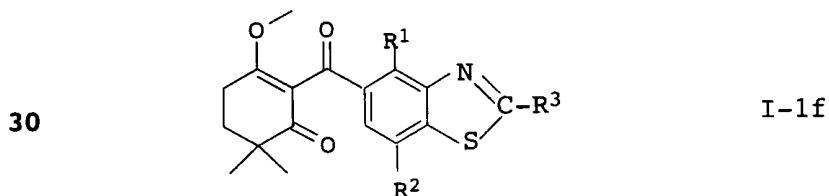


20

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1e, in der die Substituen-
 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

25

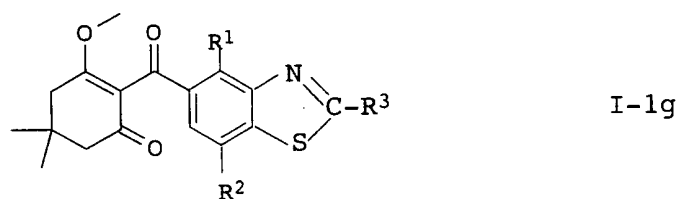
- Tabelle 6: Verbindungen I-1f.1 bis I-1f.810



35 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1f, in der die Substituen-
 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 7: Verbindungen I-1g.1 bis I-1g.810

40

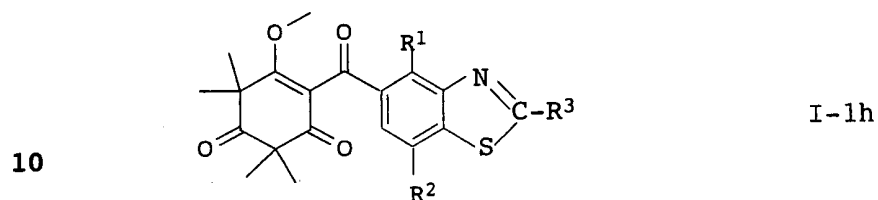


45

69

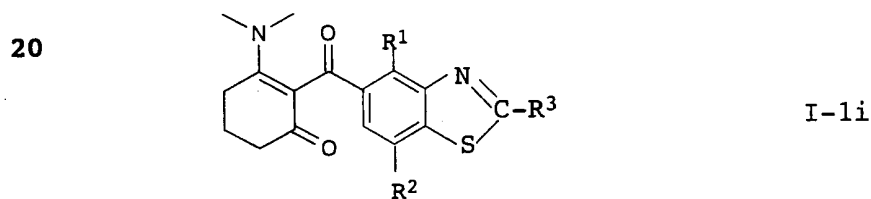
Verbindungen der allgemeinen Formel I-1g, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 8: Verbindungen I-1h.1 bis I-1h.810



15 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1h, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 9: Verbindungen I-1i.1 bis I-1i.810

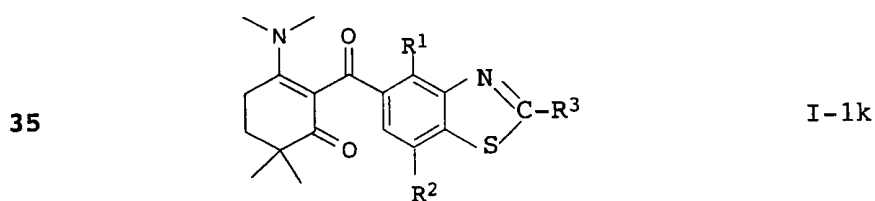


25

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1i, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

30

- Tabelle 10: Verbindungen I-1k.1 bis I-1k.810



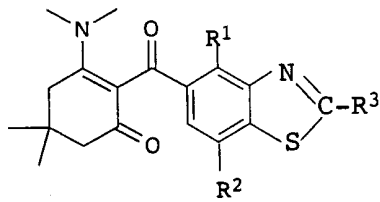
40 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1k, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 11: Verbindungen I-1l.1 bis I-1l.810

45

70

5

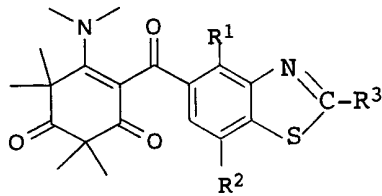


I-11

Verbindungen der allgemeinen Formel I-11, in der die Substituen-
 10 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 12: Verbindungen I-1m.1 bis I-1m.810

15



I-1m

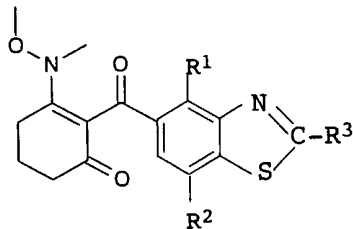
20

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1m, in der die Substituen-
 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

25

- Tabelle 13: Verbindungen I-1n.1 bis I-1n.810

30

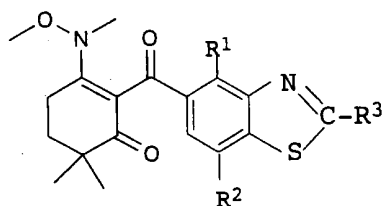


I-1n

35 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1n, in der die Substituen-
 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 14: Verbindungen I-1o.1 bis I-1o.810

40



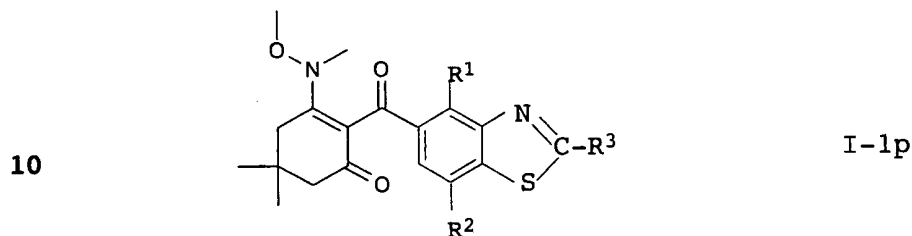
I-1o

45

71

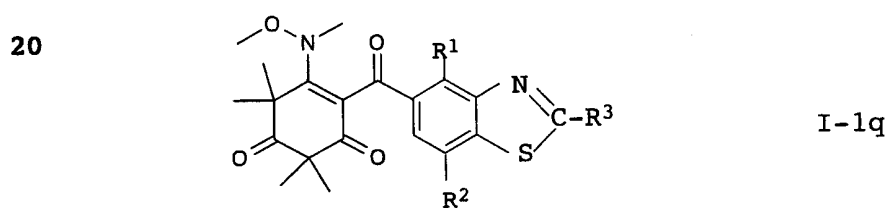
Verbindungen der allgemeinen Formel I-1p, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 15: Verbindungen I-1p.1 bis I-1p.810



Verbindungen der allgemeinen Formel I-1p, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 16: Verbindungen I-1q.1 bis I-1q.810

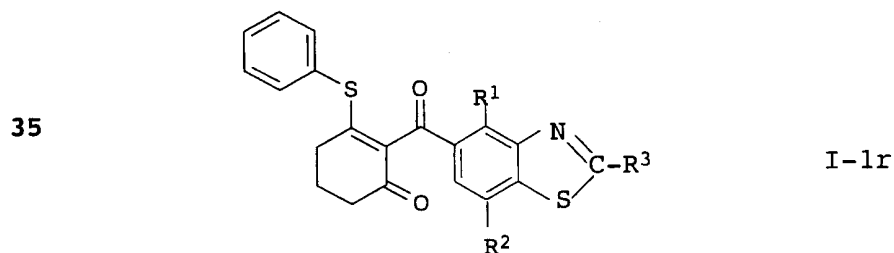


25

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1g, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

30

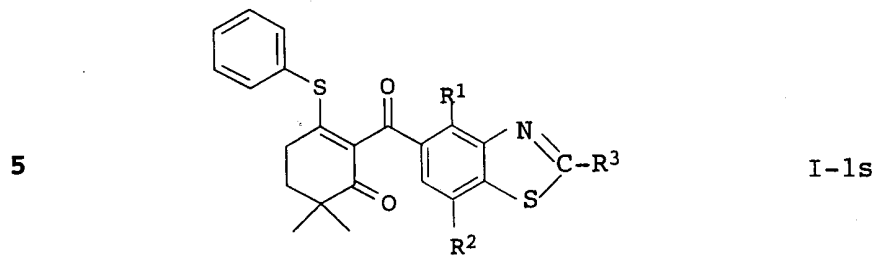
- Tabelle 17: Verbindungen I-1r.1 bis I-1r.810



40

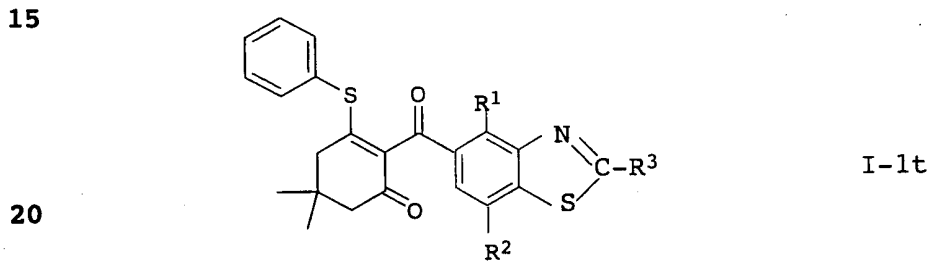
Verbindungen der allgemeinen Formel I-1r, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

45 - Tabelle 18: Verbindungen I-1s.1 bis I-1s.810



10 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1s, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

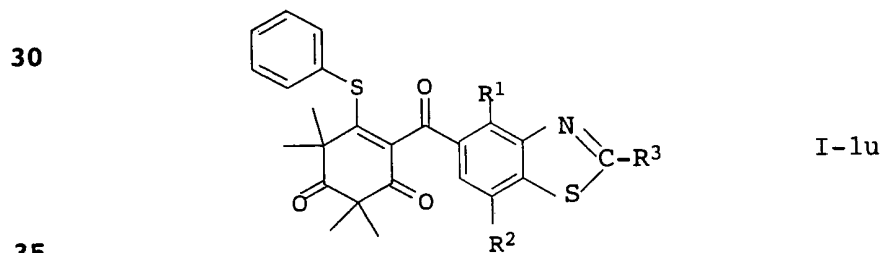
- Tabelle 19: Verbindungen I-1t.1 bis I-1t.810



Verbindungen der allgemeinen Formel I-1t, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer

25 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 20: Verbindungen I-1u.1 bis I-1u.810

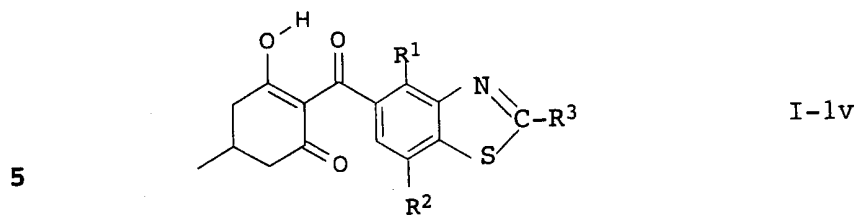


Verbindungen der allgemeinen Formel I-1u, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer

40 Zeile der Tabelle A entsprechen.

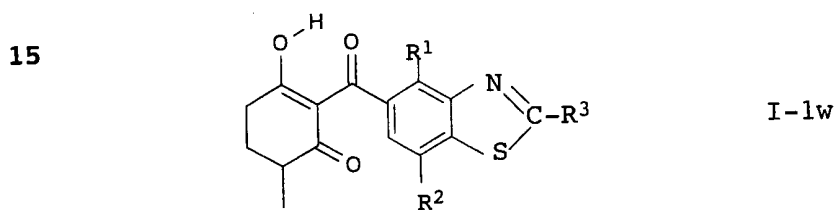
- Tabelle 21: Verbindungen I-1v.1 bis I-1v.810

73



Verbindungen der allgemeinen Formel I-lv, in der die Substituen-
 10 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 22: Verbindungen I-lw.1 bis I-lw.810

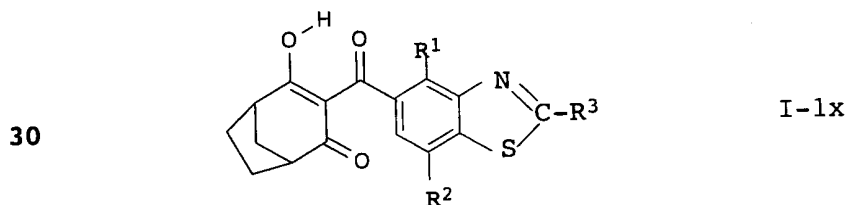


20

Verbindungen der allgemeinen Formel I-lw, in der die Substituen-
 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

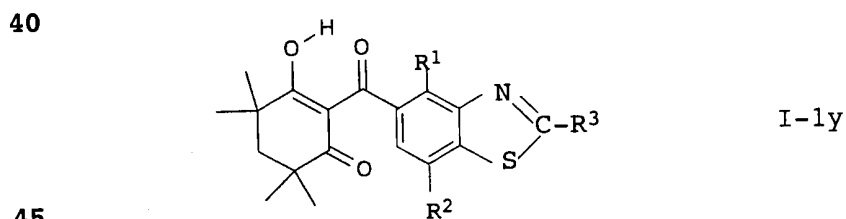
25

- Tabelle 23: Verbindungen I-lx.1 bis I-lx.810



35 Verbindungen der allgemeinen Formel I-lx, in der die Substituen-
 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

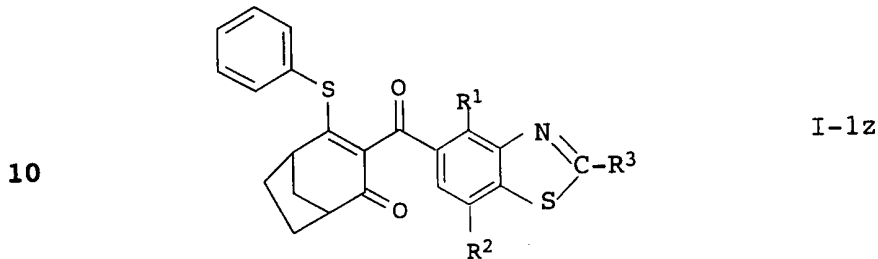
- Tabelle 24: Verbindungen I-ly.1 bis I-ly.810



74

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1y, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 25: Verbindungen I-1z.1 bis I-1z.810

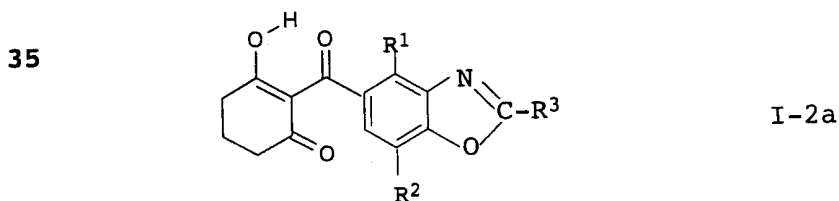


15 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1z, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Beispiele für erfindungsgemäß besonders bevorzugte Verbindungen
 20 sind sind die Benzothiazol-S-dioxidverbindungen 1-1'a.1 bis 1-1'a.810, 1-1'b.1 bis 1-1'b.810, 1-1'z.1 bis 1-1'z.810 (Verbindungen I-1' = Verbindungen I mit X = C-R³ und Y = SO₂). Sie unterscheiden sich von den in den Tabellen 1 bis 21 aufgeführten Benzothiazolverbindungen 1-1a.1 bis 1-1a.810, 1-1b.1 bis 1-1b.810, 1-1z.1 bis 1-1z.810 darin, daß das heterocyclische Schwefelatom als SO₂-Gruppe vorliegt.

Beispiele für erfindungsgemäße besonders bevorzugte Cyclohexanon-Derivate von Benzoxazol-5-carbonylverbindungen (Verbindungen I-2
 30 = Verbindungen I mit X = C-R³ und Y = O) sind die in den Tabellen 26 bis 50 genannten Verbindungen.

- Tabelle 26: Verbindungen I-2a.1 bis I-2a.810



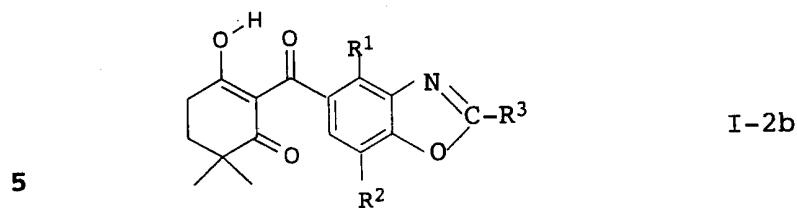
40

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2a, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

45

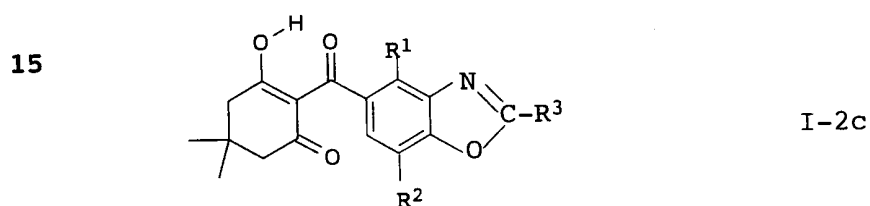
- Tabelle 27: Verbindungen I-2b.1 bis I-2b.810

75



10 Verbindungen der allgemeinen Formel I-2b, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 28: Verbindungen I-2c.1 bis I-2c.810

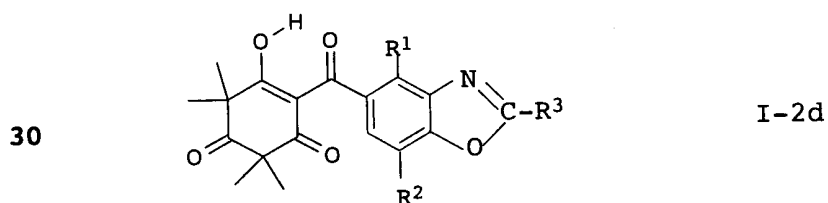


20

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2c, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

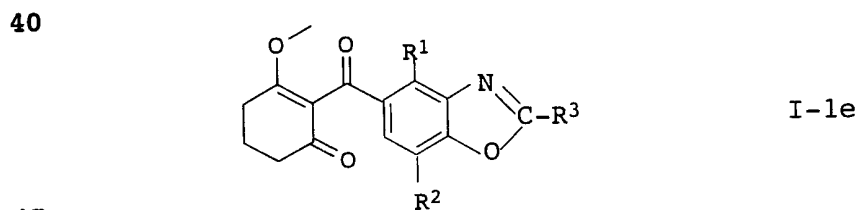
25

- Tabelle 29: Verbindungen I-2d.1 bis I-2d.810



35 Verbindungen der allgemeinen Formel I-2b, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

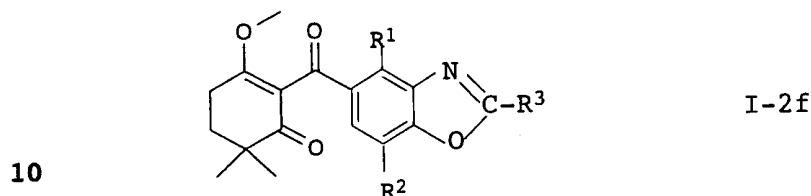
- Tabelle 30: Verbindungen I-2e.1 bis I-2e.810



76

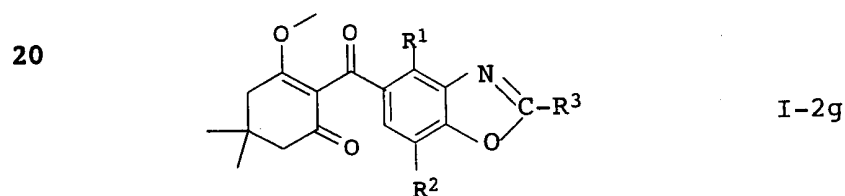
Verbindungen der allgemeinen Formel I-1e, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 31: Verbindungen I-2f.1 bis I-2f.810



15 Verbindungen der allgemeinen Formel I-2f, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 32: Verbindungen I-2g.1 bis I-2g.810

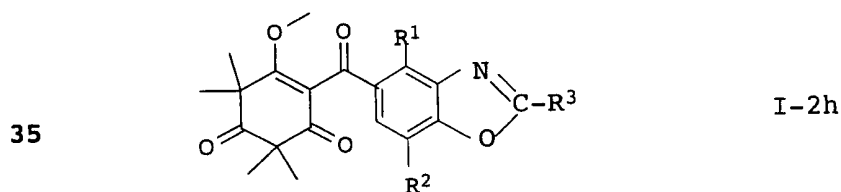


25

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2g, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

30

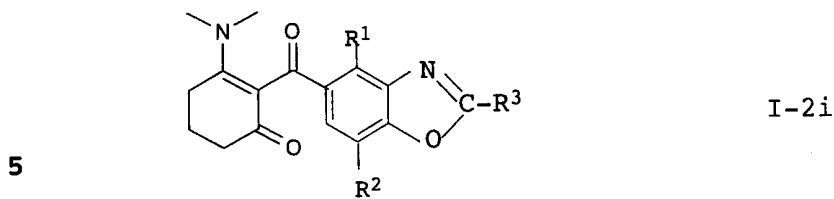
- Tabelle 33: Verbindungen I-2h.1 bis I-2h.810



40 Verbindungen der allgemeinen Formel I-2h, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

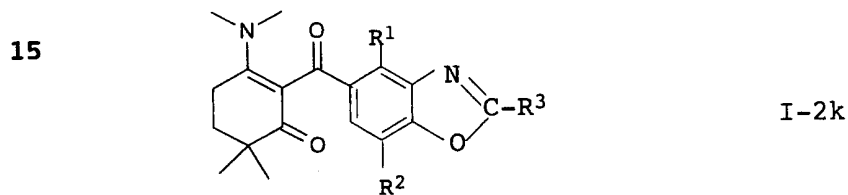
- Tabelle 34: Verbindungen I-2i.1 bis I-2i.810

45



Verbindungen der allgemeinen Formel I-2i, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 35: Verbindungen I-2k.1 bis I-2k.810

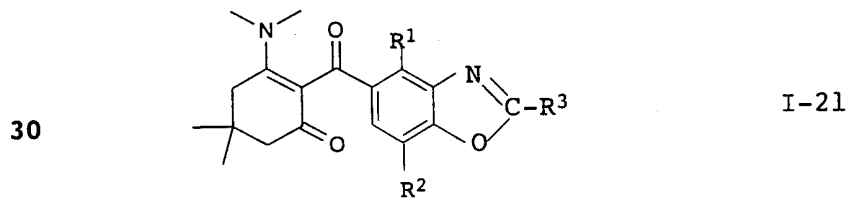


20

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2k, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

25

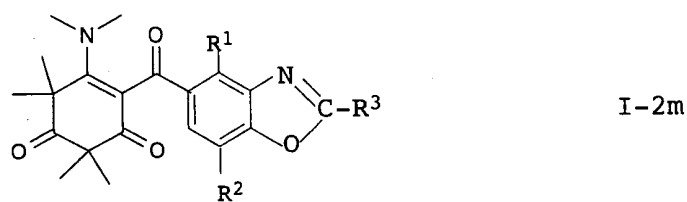
- Tabelle 36: Verbindungen I-2l.1 bis I-2l.810



35 Verbindungen der allgemeinen Formel I-2l, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 37: Verbindungen I-2m.1 bis I-2m.810

40

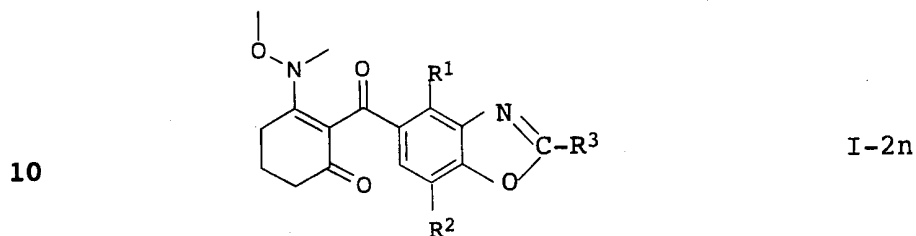


45

78

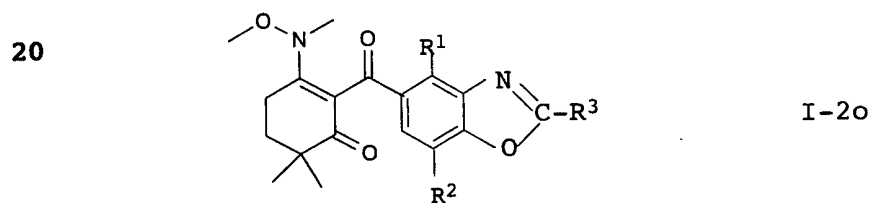
Verbindungen der allgemeinen Formel I-2m, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 38: Verbindungen I-2n.1 bis I-2n.810



15 Verbindungen der allgemeinen Formel I-2n, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 39: Verbindungen I-2o.1 bis I-2o.810

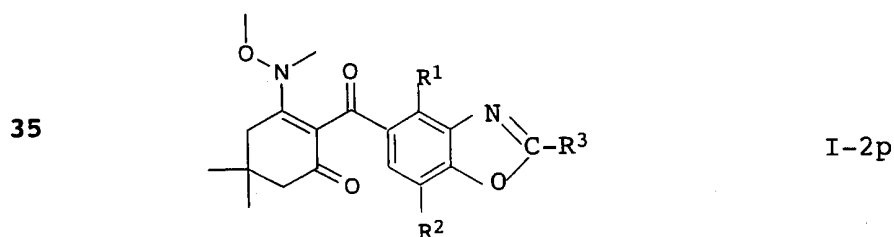


25

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2o, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

30

- Tabelle 40: Verbindungen I-2p.1 bis I-2p.810



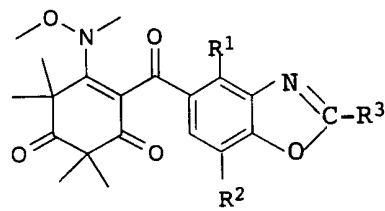
40

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2p, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

45 - Tabelle 41: Verbindungen I-2q.1 bis I-2q.810

79

5

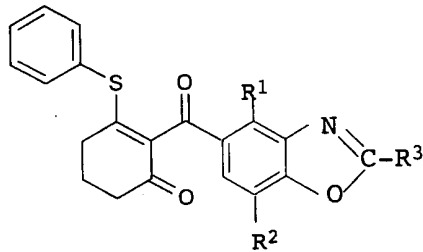


I-2q

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2q, in der die Substituen-
 10 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 42: Verbindungen I-2r.1 bis I-2r.810

15



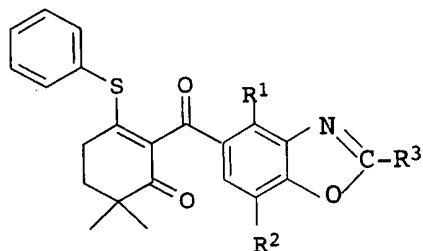
I-2r

20

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2r, in der die Substituen-
 25 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 43: Verbindungen I-2s.1 bis I-2s.810

30



I-2s

35

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2s, in der die Substituen-
 40 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

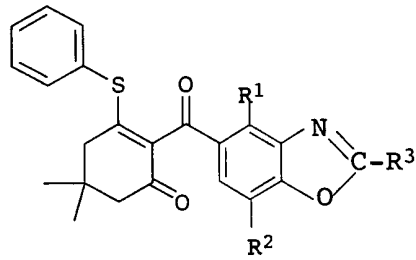
40

- Tabelle 44: Verbindungen I-2t.1 bis I-2t.810

45

80

5

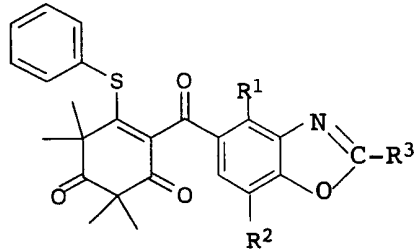


I-2t

10 Verbindungen der allgemeinen Formel I-2t, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 45: Verbindungen I-2u.1 bis I-2u.810

15



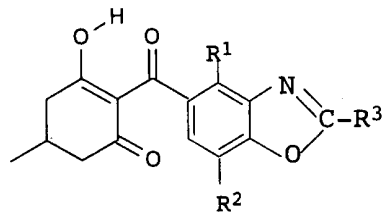
I-2u

20

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2u, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 46: Verbindungen I-2v.1 bis I-2v.810

30



I-2v

35

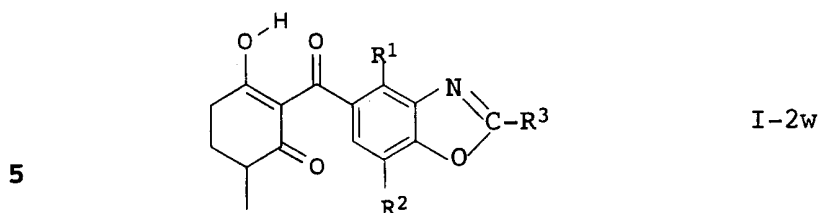
Verbindungen der allgemeinen Formel I-2v, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

40

- Tabelle 47: Verbindungen I-2w.1 bis I-2w.810

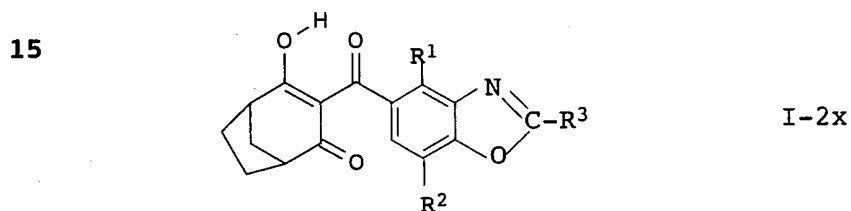
45

81



Verbindungen der allgemeinen Formel I-2w, in der die Substituen-
 10 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 48: Verbindungen I-2x.1 bis I-2x.810

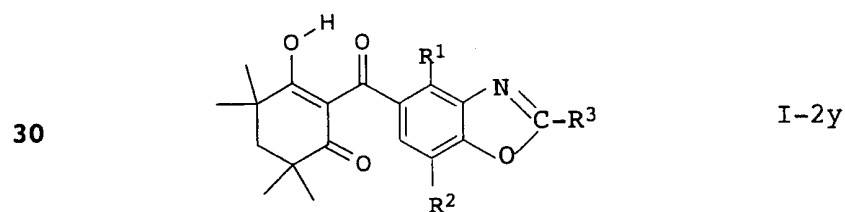


20

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2x, in der die Substituen-
 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

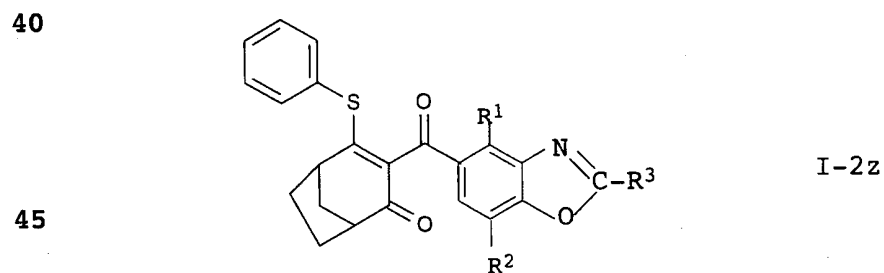
25

- Tabelle 49: Verbindungen I-2y.1 bis I-2y.810



35 Verbindungen der allgemeinen Formel I-2y, in der die Substituen-
 ten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 50: Verbindungen I-2z.1 bis I-2z.810



82

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2z, in der die Substituenten R₁, R₂ und R₃ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 In der folgenden Tabelle B sind besonders bevorzugte Kombinationen R¹, R², R³ und R⁴ für erfindungsgemäße Cyclohexanon-Derivate der allgemeinen Formel I angegeben, die sich von Benzimidazol-5-carbonsäuren ableiten.

10

15

20

25

30

35

40

45

Tabelle B

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
5	1	CH ₃	CH ₃	H
	2	C ₂ H ₅	CH ₃	H
	3	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H
	4	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
10	5	n-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	6	s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	7	i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
	8	t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
15	9	CH ₂ Cl	CH ₃	H
	10	CHCl ₂	CH ₃	H
	11	CCl ₃	CH ₃	H
	12	CH ₂ F	CH ₃	H
20	13	CHF ₂	CH ₃	H
	14	CF ₃	CH ₃	H
	15	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H
	16	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H
25	17	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H
	18	CH ₂ NH ₂	CH ₃	H
	19	(CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	H
	20	Phenyl	CH ₃	H
30	21	2-F-Phenyl	CH ₃	H
	22	3-F-Phenyl	CH ₃	H
	23	4-F-Phenyl	CH ₃	H
	24	2-Cl-Phenyl	CH ₃	H
35	25	3-Cl-Phenyl	CH ₃	H
	26	4-Cl-Phenyl	CH ₃	H
	27	2-OH-Phenyl	CH ₃	H
	28	3-OH-Phenyl	CH ₃	H
40	29	4-OH-Phenyl	CH ₃	H
	30	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	31	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	32	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H
45	33	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	34	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	35	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H
	36	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	3- OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
5	39 2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
	40 3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
	41 4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
	42 2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
10	43 3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
	44 4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
	45 2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
	46 3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
	47 4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	H
15	48 2-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	H
	49 3-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	H
	50 4-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	H
	51 Cyclohexylamino	CH ₃	CH ₃	H
20	52 Cyclopentylamino	CH ₃	CH ₃	H
	53 H	OCH ₃	CH ₃	H
	54 CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
	55 C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	H
25	56 n-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	H
	57 i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	H
	58 n-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	H
	59 s-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	H
30	60 i-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	H
	61 t-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	H
	62 CH ₂ Cl	OCH ₃	CH ₃	H
	63 CHCl ₂	OCH ₃	CH ₃	H
	64 CCl ₃	OCH ₃	CH ₃	H
35	65 CH ₂ F	OCH ₃	CH ₃	H
	66 CHF ₂	OCH ₃	CH ₃	H
	67 CF ₃	OCH ₃	CH ₃	H
	68 CH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH ₃	H
40	69 CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
	70 CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
	71 CH ₂ NH ₂	OCH ₃	CH ₃	H
	72 (CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
45	73 Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	74 2-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	75 3-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	4-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
5	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	2-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	3-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
10	4-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
15	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
20	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
25	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
30	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	H
	2-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	H
	3-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	H
	4-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	H
35	Cyclohexylamino	OCH ₃	CH ₃	H
	Cyclopentylamino	OCH ₃	CH ₃	H
	H	Cl	CH ₃	H
	CH ₃	Cl	CH ₃	H
40	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H
	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	H
	i-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	H
	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	H
	s-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	H
45	i-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	H
	t-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	H

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	115	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃	H
	116	CHCl ₂	Cl	CH ₃	H
5	117	CCl ₃	Cl	CH ₃	H
	118	CH ₂ F	Cl	CH ₃	H
	119	CHF ₂	Cl	CH ₃	H
	120	CF ₃	Cl	CH ₃	H
10	121	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₃	H
	122	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃	H
	123	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	H
	124	CH ₂ NH ₂	Cl	CH ₃	H
	125	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	CH ₃	H
15	126	Phenyl	Cl	CH ₃	H
	127	2-F-Phenyl	Cl	CH ₃	H
	128	3-F-Phenyl	Cl	CH ₃	H
	129	4-F-Phenyl	Cl	CH ₃	H
20	130	2-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	H
	131	3-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	H
	132	4-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	H
	133	2-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	H
25	134	3-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	H
	135	4-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	H
	136	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	137	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	138	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
30	139	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	140	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	141	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	142	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
35	143	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	144	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	145	2-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	146	3-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
40	147	4-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	148	2-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	149	3-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	150	4-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
45	151	2-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	152	3-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	H
	153	4-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	H

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	154	2-Pyridyl	Cl	CH ₃	H
	155	3-Pyridyl	Cl	CH ₃	H
5	156	4-Pyridyl	Cl	CH ₃	H
	157	Cyclohexylamino	Cl	CH ₃	H
	158	Cyclopentylamino	Cl	CH ₃	H
	159	CH ₃	CH ₃	H	H
10	160	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
	161	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	H
	162	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	H
	163	n-C ₄ H ₉	CH ₃	H	H
	164	s-C ₄ H ₉	CH ₃	H	H
15	165	i-C ₄ H ₉	CH ₃	H	H
	166	t-C ₄ H ₉	CH ₃	H	H
	167	CH ₂ Cl	CH ₃	H	H
	168	CHCl ₂	CH ₃	H	H
20	169	CCl ₃	CH ₃	H	H
	170	CH ₂ F	CH ₃	H	H
	171	CHF ₂	CH ₃	H	H
	172	CF ₃	CH ₃	H	H
25	173	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	H
	174	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	H
	175	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H
	176	CH ₂ NH ₂	CH ₃	H	H
	177	(CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	H	H
30	178	Phenyl	CH ₃	H	H
	179	2-F-Phenyl	CH ₃	H	H
	180	3-F-Phenyl	CH ₃	H	H
	181	4-F-Phenyl	CH ₃	H	H
35	182	2-Cl-Phenyl	CH ₃	H	H
	183	3-Cl-Phenyl	CH ₃	H	H
	184	4-Cl-Phenyl	CH ₃	H	H
	185	2-OH-Phenyl	CH ₃	H	H
40	186	3-OH-Phenyl	CH ₃	H	H
	187	4-OH-Phenyl	CH ₃	H	H
	188	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	189	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	190	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
45	191	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	192	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	H
5	3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	H
	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	H
	2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
10	4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	H
	2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	H
15	3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	H
	4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	H
	2-Pyridyl	CH ₃	H	H
	3-Pyridyl	CH ₃	H	H
20	4-Pyridyl	CH ₃	H	H
	Cyclohexylamino	CH ₃	H	H
	Cyclopentylamino	CH ₃	H	H
	H	OCH ₃	H	H
25	CH ₃	OCH ₃	H	H
	C ₂ H ₅	OCH ₃	H	H
	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	H	H
	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	H	H
30	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	H
	s-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	H
	i-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	H
	t-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	H
	CH ₂ Cl	OCH ₃	H	H
35	CHCl ₂	OCH ₃	H	H
	CCl ₃	OCH ₃	H	H
	CH ₂ F	OCH ₃	H	H
	CHF ₂	OCH ₃	H	H
40	CF ₃	OCH ₃	H	H
	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H
	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	H	H
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	H
45	CH ₂ NH ₂	OCH ₃	H	H
	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	H	H
	Phenyl	OCH ₃	H	H

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	2-F-Phenyl	OCH ₃	H	H
	3-F-Phenyl	OCH ₃	H	H
5	4-F-Phenyl	OCH ₃	H	H
	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	H
	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	H
	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	H
10	2-OH-Phenyl	OCH ₃	H	H
	3-OH-Phenyl	OCH ₃	H	H
	4-OH-Phenyl	OCH ₃	H	H
	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
15	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
20	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
25	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
30	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	H
	2-Pyridyl	OCH ₃	H	H
35	3-Pyridyl	OCH ₃	H	H
	4-Pyridyl	OCH ₃	H	H
	Cyclohexylamino	OCH ₃	H	H
	Cyclopentylamino	OCH ₃	H	H
40	H	Cl	H	H
	CH ₃	Cl	H	H
	C ₂ H ₅	Cl	H	H
	n-C ₃ H ₇	Cl	H	H
45	i-C ₃ H ₇	Cl	H	H
	n-C ₄ H ₉	Cl	H	H
	s-C ₄ H ₉	Cl	H	H

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	271	i-C ₄ H ₉	Cl	H	H
	272	t-C ₄ H ₉	Cl	H	H
5	273	CH ₂ Cl	Cl	H	H
	274	CHCl ₂	Cl	H	H
	275	CCl ₃	Cl	H	H
	276	CH ₂ F	Cl	H	H
10	277	CHF ₂	Cl	H	H
	278	CF ₃	Cl	H	H
	279	CH ₂ CF ₃	Cl	H	H
	280	CH ₂ OCH ₃	Cl	H	H
	281	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	H	H
15	282	CH ₂ NH ₂	Cl	H	H
	283	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	H	H
	284	Phenyl	Cl	H	H
	285	2-F-Phenyl	Cl	H	H
20	286	3-F-Phenyl	Cl	H	H
	287	4-F-Phenyl	Cl	H	H
	288	2-Cl-Phenyl	Cl	H	H
	289	3-Cl-Phenyl	Cl	H	H
25	290	4-Cl-Phenyl	Cl	H	H
	291	2-OH-Phenyl	Cl	H	H
	292	3-OH-Phenyl	Cl	H	H
	293	4-OH-Phenyl	Cl	H	H
	294	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	H
30	295	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	296	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	297	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	298	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	H
35	299	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	300	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	H
	301	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	H
	302	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	H
40	303	2-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	304	3-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	305	4-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	306	2-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	307	3-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	H
45	308	4-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	H
	309	2-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	H

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	3-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	H
	4-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	H
5	2-Pyridyl	Cl	H	H
	3-Pyridyl	Cl	H	H
	4-Pyridyl	Cl	H	H
	Cyclohexylamino	Cl	H	H
10	Cyclopentylamino	Cl	H	H
	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	CH ₃
15	n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	s-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	t-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	CH ₃
20	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	CHCl ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	CCl ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
25	CHF ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
30	CH ₂ NH ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	(CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
35	3-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
40	4-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
45	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
5	351 4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	352 2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	353 3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	354 4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
10	355 2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	356 3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	357 4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	358 2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	359 3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
15	360 4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	361 2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	362 3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	363 4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
20	364 2-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	365 3-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	366 4-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	367 Cyclohexylamino	CH ₃	CH ₃	CH ₃
25	368 Cyclopentylamino	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	369 H	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	370 CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	371 C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	372 n-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
30	373 i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	374 n-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	375 s-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	376 i-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
35	377 t-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	378 CH ₂ Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	379 CHCl ₂	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	380 CCl ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
40	381 CH ₂ F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	382 CHF ₂	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	383 CF ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	384 CH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	385 CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
45	386 CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	387 CH ₂ NH ₂	OCH ₃	CH ₃	CH ₃

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
5	2-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
10	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
15	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
20	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
25	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
30	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
35	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	2-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	3-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	4-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
40	Cyclohexylamino	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	Cyclopentylamino	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
	H	Cl	CH ₃	CH ₃
	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	CH ₃
45	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	CH ₃
	i-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	CH ₃

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	CH ₃
	s-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	CH ₃
5	i-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	CH ₃
	t-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃	CH ₃
	CHCl ₂	Cl	CH ₃	CH ₃
10	CCl ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ F	Cl	CH ₃	CH ₃
	CHF ₂	Cl	CH ₃	CH ₃
	CF ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
15	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
	CH ₂ NH ₂	Cl	CH ₃	CH ₃
	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
20	Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	2-F-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	3-F-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	4-F-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
25	2-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	3-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	4-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	2-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
30	3-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	4-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
35	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
40	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	2-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	3-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
45	4-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	2-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	3-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	4-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	2-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
5	468 3-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	469 4-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	470 2-Pyridyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	471 3-Pyridyl	Cl	CH ₃	CH ₃
10	472 4-Pyridyl	Cl	CH ₃	CH ₃
	473 Cyclohexylamino	Cl	CH ₃	CH ₃
	474 Cyclopentylamino	Cl	CH ₃	CH ₃
	475 CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
	476 C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃
15	477 n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	CH ₃
	478 i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	CH ₃
	479 n-C ₄ H ₉	CH ₃	H	CH ₃
	480 s-C ₄ H ₉	CH ₃	H	CH ₃
20	481 i-C ₄ H ₉	CH ₃	H	CH ₃
	482 t-C ₄ H ₉	CH ₃	H	CH ₃
	483 CH ₂ Cl	CH ₃	H	CH ₃
	484 CHCl ₂	CH ₃	H	CH ₃
25	485 CCl ₃	CH ₃	H	CH ₃
	486 CH ₂ F	CH ₃	H	CH ₃
	487 CHF ₂	CH ₃	H	CH ₃
	488 CF ₃	CH ₃	H	CH ₃
	489 CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	CH ₃
30	490 CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
	491 CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
	492 CH ₂ NH ₂	CH ₃	H	CH ₃
	493 (CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
35	494 Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	495 2-F-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	496 3-F-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	497 4-F-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
40	498 2-Cl-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	499 3-Cl-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	500 4-Cl-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	501 2-OH-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	502 3-OH-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
45	503 4-OH-Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	504 2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	505	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	506	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
5	507	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	508	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	509	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	510	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
10	511	3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	512	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	513	2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	514	3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	515	4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
15	516	2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	517	3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	518	4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	519	2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
20	520	3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	521	4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	CH ₃
	522	2-Pyridyl	CH ₃	H	CH ₃
	523	3-Pyridyl	CH ₃	H	CH ₃
25	524	4-Pyridyl	CH ₃	H	CH ₃
	525	Cyclohexylamino	CH ₃	H	CH ₃
	526	Cyclopentylamino	CH ₃	H	CH ₃
	527	H	OCH ₃	H	CH ₃
	528	CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
30	529	C ₂ H ₅	OCH ₃	H	CH ₃
	530	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	H	CH ₃
	531	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	H	CH ₃
	532	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	CH ₃
35	533	s-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	CH ₃
	534	i-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	CH ₃
	535	t-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	CH ₃
	536	CH ₂ Cl	OCH ₃	H	CH ₃
40	537	CHCl ₂	OCH ₃	H	CH ₃
	538	CCl ₃	OCH ₃	H	CH ₃
	539	CH ₂ F	OCH ₃	H	CH ₃
	540	CHF ₂	OCH ₃	H	CH ₃
45	541	CF ₃	OCH ₃	H	CH ₃
	542	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H	CH ₃
	543	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	544	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
	545	CH ₂ NH ₂	OCH ₃	H	CH ₃
5	546	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
	547	Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	548	2-F-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	549	3-F-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	550	4-F-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
10	551	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	552	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	553	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	554	2-OH-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
15	555	3-OH-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	556	4-OH-Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	557	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	558	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
20	559	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	560	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	561	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	562	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
25	563	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	564	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	565	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	566	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	567	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
30	568	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	569	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	570	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	571	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
35	572	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	573	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	574	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	CH ₃
	575	2-Pyridyl	OCH ₃	H	CH ₃
40	576	3-Pyridyl	OCH ₃	H	CH ₃
	577	4-Pyridyl	OCH ₃	H	CH ₃
	578	Cyclohexylamino	OCH ₃	H	CH ₃
	579	Cyclopentylamino	OCH ₃	H	CH ₃
45	580	H	Cl	H	CH ₃
	581	CH ₃	Cl	H	CH ₃
	582	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	583	n-C ₃ H ₇	Cl	H	CH ₃
	584	i-C ₃ H ₇	Cl	H	CH ₃
5	585	n-C ₄ H ₉	Cl	H	CH ₃
	586	s-C ₄ H ₉	Cl	H	CH ₃
	587	i-C ₄ H ₉	Cl	H	CH ₃
	588	t-C ₄ H ₉	Cl	H	CH ₃
10	589	CH ₂ Cl	Cl	H	CH ₃
	590	CHCl ₂	Cl	H	CH ₃
	591	CCl ₃	Cl	H	CH ₃
	592	CH ₂ F	Cl	H	CH ₃
15	593	CHF ₂	Cl	H	CH ₃
	594	CF ₃	Cl	H	CH ₃
	595	CH ₂ CF ₃	Cl	H	CH ₃
	596	CH ₂ OCH ₃	Cl	H	CH ₃
	597	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	H	CH ₃
20	598	CH ₂ NH ₂	Cl	H	CH ₃
	599	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	H	CH ₃
	600	Phenyl	Cl	H	CH ₃
	701	2-F-Phenyl	Cl	H	CH ₃
25	702	3-F-Phenyl	Cl	H	CH ₃
	703	4-F-Phenyl	Cl	H	CH ₃
	704	2-Cl-Phenyl	Cl	H	CH ₃
	705	3-Cl-Phenyl	Cl	H	CH ₃
	706	4-Cl-Phenyl	Cl	H	CH ₃
30	707	2-OH-Phenyl	Cl	H	CH ₃
	708	3-OH-Phenyl	Cl	H	CH ₃
	709	4-OH-Phenyl	Cl	H	CH ₃
	710	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
35	711	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	712	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	713	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	714	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
40	715	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	716	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	717	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	718	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	719	2-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
45	720	3-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	721	4-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
5	722	2-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	723	3-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	724	4-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	725	2-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	726	3-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
10	727	4-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	CH ₃
	728	2-Pyridyl	Cl	H	CH ₃
	729	3-Pyridyl	Cl	H	CH ₃
	730	4-Pyridyl	Cl	H	CH ₃
15	731	Cyclohexylamino	Cl	H	CH ₃
	732	Cyclopentylamino	Cl	H	CH ₃
	733	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
20	734	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	735	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	736	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	737	n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	738	s-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	739	i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	740	t-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
25	741	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	742	CHCl ₂	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	743	CCl ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	744	CH ₂ F	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
30	745	CHF ₂	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	746	CF ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	747	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
35	748	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	749	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	750	CH ₂ NH ₂	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	751	(CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
40	752	Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	753	2-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	754	3-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	755	4-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	756	2-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
45	757	3-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	758	4-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	759	2-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅

100

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	760	3-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	761	4-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
5	762	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	763	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	764	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	765	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
10	766	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	767	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	768	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	769	3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	770	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
15	771	2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	772	3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	773	4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	774	2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
20	775	3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	776	4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	777	2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	778	3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	779	4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
25	780	2-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	781	3-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	782	4-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	783	Cyclohexylamino	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
30	784	Cyclopentylamino	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	785	H	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	786	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	787	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
35	788	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	789	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	790	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	791	s-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
40	792	i-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	793	t-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	794	CH ₂ Cl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	795	CHCl ₂	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	796	CCl ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
45	797	CH ₂ F	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	798	CHF ₂	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅

101

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	799	CF ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	800	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
5	801	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	802	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	803	CH ₂ NH ₂	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	804	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
10	805	Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	806	2-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	807	3-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	808	4-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	809	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
15	810	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	811	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	812	2-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	813	3-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
20	814	4-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	815	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	816	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	817	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
25	818	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	819	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	820	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	821	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	822	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
30	823	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	824	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	825	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	826	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
35	827	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	828	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	829	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	830	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
40	831	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	832	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	833	2-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	834	3-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	835	4-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
45	836	Cyclohexylamino	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	837	Cyclopentylamino	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅

102

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	H	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CH ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
5	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	i-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
10	s-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	i-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	t-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CHCl ₂	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
15	CCl ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CH ₂ F	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CHF ₂	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CF ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
20	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	CH ₂ NH ₂	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
25	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	2-F-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	3-F-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	4-F-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
30	2-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	3-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	4-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	2-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
35	3-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	4-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
40	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
45	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅

103

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	877	2-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	878	3-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
5	879	4-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	880	2-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	881	3-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	882	4-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
10	883	2-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	884	3-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	885	4-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	886	2-Pyridyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	887	3-Pyridyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
15	888	4-Pyridyl	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	889	Cyclohexylamino	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	890	Cyclopentylamino	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅
	891	CH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
20	892	C ₂ H ₅	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	893	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	894	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	895	n-C ₄ H ₉	CH ₃	H	C ₂ H ₅
25	896	s-C ₄ H ₉	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	897	i-C ₄ H ₉	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	898	t-C ₄ H ₉	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	899	CH ₂ Cl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	900	CHCl ₂	CH ₃	H	C ₂ H ₅
30	901	CCl ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	902	CH ₂ F	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	903	CHF ₂	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	904	CF ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
35	905	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	906	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	907	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	908	CH ₂ NH ₂	CH ₃	H	C ₂ H ₅
40	909	(CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	910	Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	911	2-F-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	912	3-F-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	913	4-F-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
45	914	2-Cl-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	915	3-Cl-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅

104

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	4-Cl-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	2-OH-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
5	3-OH-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	4-OH-Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
10	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
15	3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
20	4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
25	2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	2-Pyridyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	3-Pyridyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
30	4-Pyridyl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	Cyclohexylamino	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	Cyclopentylamino	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	H	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
35	CH ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	C ₂ H ₅	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
40	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	s-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	i-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	t-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	CH ₂ Cl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
45	CHCl ₂	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	CCl ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅

105

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	955	CH ₂ F	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	956	CHF ₂	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
5	957	CF ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	958	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	959	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	960	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
10	961	CH ₂ NH ₂	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	962	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	963	Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	964	2-F-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	965	3-F-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
15	966	4-F-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	967	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	968	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	969	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
20	970	2-OH-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	971	3-OH-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	972	4-OH-Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	973	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
25	974	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	975	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	976	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	977	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	978	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
30	979	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	980	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	981	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	982	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
35	983	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	984	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	985	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	986	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
40	987	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	988	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	989	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	990	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
45	991	2-Pyridyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	992	3-Pyridyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	993	4-Pyridyl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅

106

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	994	Cyclohexylamino	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	995	Cyclopentylamino	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
5	996	H	Cl	H	C ₂ H ₅
	997	CH ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
	998	C ₂ H ₅	Cl	H	C ₂ H ₅
	999	n-C ₃ H ₇	Cl	H	C ₂ H ₅
	999	i-C ₃ H ₇	Cl	H	C ₂ H ₅
10	1000	n-C ₄ H ₉	Cl	H	C ₂ H ₅
	1001	s-C ₄ H ₉	Cl	H	C ₂ H ₅
	1002	i-C ₄ H ₉	Cl	H	C ₂ H ₅
	1003	t-C ₄ H ₉	Cl	H	C ₂ H ₅
15	1004	CH ₂ Cl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1005	CHCl ₂	Cl	H	C ₂ H ₅
	1006	CCl ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
	1007	CH ₂ F	Cl	H	C ₂ H ₅
20	1008	CHF ₂	Cl	H	C ₂ H ₅
	1009	CF ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
	1010	CH ₂ CF ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
	1011	CH ₂ OCH ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
25	1012	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
	1013	CH ₂ NH ₂	Cl	H	C ₂ H ₅
	1014	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
	1015	Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
30	1016	2-F-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1017	3-F-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1018	4-F-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1019	2-Cl-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1020	3-Cl-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
35	1021	4-Cl-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1022	2-OH-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1023	3-OH-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1024	4-OH-Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
40	1025	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1026	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1027	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1028	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1029	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
45	1030	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1031	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅

107

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
5	1034 2-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1035 3-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1036 4-CF ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1037 2-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
10	1038 3-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1039 4-CH ₃ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1040 2-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1041 3-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1042 4-NO ₂ -Phenyl	Cl	H	C ₂ H ₅
15	1043 2-Pyridyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1044 3-Pyridyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1045 4-Pyridyl	Cl	H	C ₂ H ₅
	1046 Cyclohexylamino	Cl	H	C ₂ H ₅
20	1047 Cyclopentylamino	Cl	H	C ₂ H ₅
	1048 CH ₃	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1049 C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1050 n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
25	1051 i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1052 n-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1053 s-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1054 i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1055 t-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
30	1056 CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1057 CHCl ₂	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1058 CCl ₃	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1059 CH ₂ F	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
35	1060 CHF ₂	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1061 CF ₃	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1062 CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1063 CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
40	1064 CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1065 CH ₂ NH ₂	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1066 (CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1067 Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
45	1068 2-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1069 3-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1070 4-F-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇

108

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	1071	2-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1072	3-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
5	1073	4-Cl-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1074	2-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1075	3-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1076	4-OH-Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
10	1077	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1078	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1079	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1080	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1081	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
15	1082	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1083	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1084	3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1085	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
20	1086	2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1087	3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1088	4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1089	2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
25	1090	3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1091	4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1092	2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1093	3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1094	4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
30	1095	2-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1096	3-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1097	4-Pyridyl	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1098	Cyclohexylamino	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
35	1099	Cyclopentylamino	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1100	H	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1101	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1102	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
40	1103	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1104	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1105	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1106	s-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1107	i-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
45	1108	t-C ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1109	CH ₂ Cl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇

109

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	1110	CHCl ₂	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1111	CCl ₃	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
5	1112	CH ₂ F	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1113	CHF ₂	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1114	CF ₃	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1115	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
10	1116	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1117	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1118	CH ₂ NH ₂	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1119	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
15	1120	Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1121	2-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1122	3-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1123	4-F-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1124	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
20	1125	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1126	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1127	2-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1128	3-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
25	1129	4-OH-Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1130	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1131	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1132	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1133	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
30	1134	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1135	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1136	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1137	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
35	1138	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1139	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1140	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1141	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
40	1142	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1143	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1144	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1145	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
45	1146	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1147	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1148	2-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇

110

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	1149	3-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1150	4-Pyridyl	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
5	1151	Cyclohexylamino	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1152	Cyclopentylamino	OCH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1153	H	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1154	CH ₃	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1155	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
10	1156	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1157	i-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1158	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1159	s-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
15	1160	i-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1161	t-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1162	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1163	CHCl ₂	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
20	1164	CCl ₃	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1165	CH ₂ F	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1166	CHF ₂	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1167	CF ₃	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
25	1168	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1169	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1170	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1171	CH ₂ NH ₂	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1172	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
30	1173	Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1174	2-F-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1175	3-F-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1176	4-F-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
35	1177	2-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1178	3-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1179	4-Cl-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1180	2-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
40	1181	3-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1182	4-OH-Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1183	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1184	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1185	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
45	1186	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1187	3-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇

111

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	1188	4-OCF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1189	2-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
5	1190	3-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1191	4-OCHF ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1192	2-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1193	3-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
10	1194	4-CF ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1195	2-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1196	3-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1197	4-CH ₃ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1198	2-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
15	1199	3-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1200	4-NO ₂ -Phenyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1201	2-Pyridyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1202	3-Pyridyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
20	1203	4-Pyridyl	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1204	Cyclohexylamino	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1205	Cyclopentylamino	Cl	CH ₃	i-C ₃ H ₇
	1206	CH ₃	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
25	1207	C ₂ H ₅	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1208	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1209	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1210	n-C ₄ H ₉	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
30	1211	s-C ₄ H ₉	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1212	i-C ₄ H ₉	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1213	t-C ₄ H ₉	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1214	CH ₂ Cl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1215	CHCl ₂	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
35	1116	CCl ₃	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1217	CH ₂ F	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1218	CHF ₂	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1219	CF ₃	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
40	1220	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1221	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1222	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1223	CH ₂ NH ₂	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
45	1224	(CH ₂) ₂ COCH ₃	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1225	Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1226	2-F-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇

112

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴	
	1227	3-F-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1228	4-F-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
5	1229	2-Cl-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1230	3-Cl-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1231	4-Cl-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1232	2-OH-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
10	1233	3-OH-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1234	4-OH-Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1235	2-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1236	3-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1237	4-OCH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
15	1238	2-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1239	3-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1240	4-OCF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1241	2-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
20	1242	3-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1243	4-OCHF ₂ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1244	2-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1245	3-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
25	1246	4-CF ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1247	2-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1248	3-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1249	4-CH ₃ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1250	2-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
30	1251	3-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1252	4-NO ₂ -Phenyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1253	2-Pyridyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1254	3-Pyridyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
35	1255	4-Pyridyl	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1256	Cyclohexylamino	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1257	Cyclopentylamino	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1258	H	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
40	1259	CH ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1260	C ₂ H ₅	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1261	n-C ₃ H ₇	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1262	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1263	n-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
45	1264	s-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	1265	i-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇

113

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	t-C ₄ H ₉	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ Cl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
5	CHCl ₂	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	CCl ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ F	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	CHF ₂	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
10	CF ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ NH ₂	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
15	(CH ₂) ₂ COCH ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-F-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-F-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
20	4-F-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-Cl-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
25	2-OH-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-OH-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-OH-Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
30	4-OCH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
35	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
40	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
45	2-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	4-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-Pyridyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
5	3-Pyridyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-Pyridyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	Cyclohexylamino	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	Cyclopentylamino	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
10	H	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₃	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	C ₂ H ₅	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	n-C ₃ H ₇	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	i-C ₃ H ₇	Cl	H	i-C ₃ H ₇
15	n-C ₄ H ₉	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	s-C ₄ H ₉	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	i-C ₄ H ₉	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	t-C ₄ H ₉	Cl	H	i-C ₃ H ₇
20	CH ₂ Cl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	CHCl ₂	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₃	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ F	Cl	H	i-C ₃ H ₇
25	CHF ₂	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	CF ₃	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ CF ₃	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ OCH ₃	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	Cl	H	i-C ₃ H ₇
30	CH ₂ NH ₂	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	2-F-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
35	3-F-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	4-F-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	2-Cl-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	3-Cl-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
40	4-Cl-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	2-OH-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	3-OH-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	4-OH-Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
45	2-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	3-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	4-OCH ₃ -Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇

115

	R ³	R ¹	R ²	R ⁴
	2-OCF ₃ -Phenyl	Cl	H	i-C ₃ H ₇
	3-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
5	4-OCF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-OCHF ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
10	2-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	4-CF ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	2-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	3-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
15	4-CH ₃ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	H	CH ₃	H	H
	3-NO ₂ -Phenyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
20	2-Pyridyl	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	H	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇
25	H	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇
	H	CH ₃	H	CH ₃

30

35

40

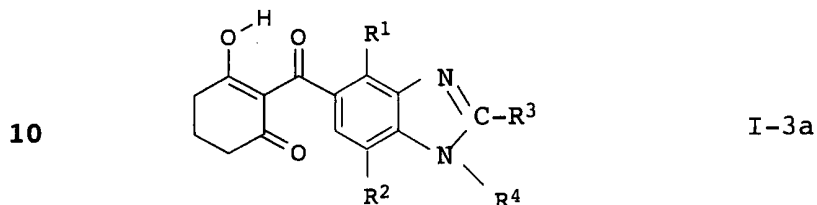
45

116

Beispiele für erfindungsgemäße besonders bevorzugte Benzimidazol-5-ylcarbonyl-Derivate von Cyclohexenonen (Verbindungen I-3 = Verbindungen I mit $X = C-R^3$ und $Y = N-R^4$) sind die in den Tabellen 51 bis 75 genannten Verbindungen.

5

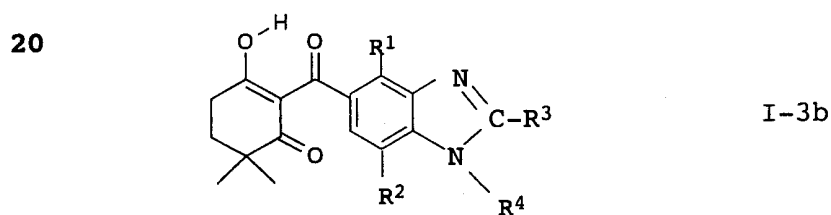
- Tabelle 51: Verbindungen I-3a.1 bis I-3a.1363



Verbindungen der allgemeinen Formel I-3a, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

15

- Tabelle 52: Verbindungen I-3b.1 bis I-3b.1363

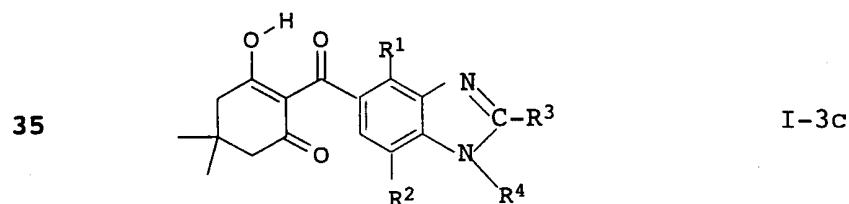


25

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3b, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

30

- Tabelle 53: Verbindungen I-3c.1 bis I-3c.1363

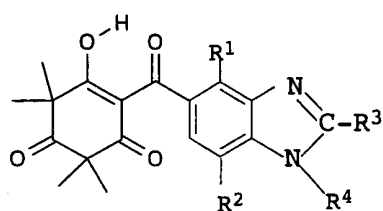


40 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3c, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

45

- Tabelle 54: Verbindungen I-3d.1 bis I-3d.1363

5

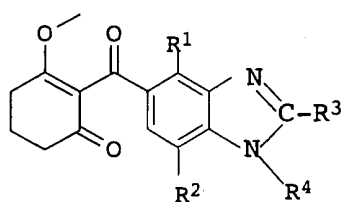


I-3d

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3d, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 55: Verbindungen I-3e.1 bis I-3e.1363

15

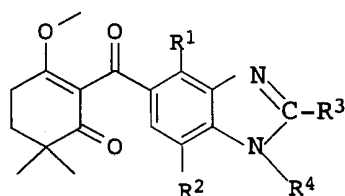


I-3e

20 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3e, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 56: Verbindungen I-3f.1 bis I-3f.1363

25



I-3f

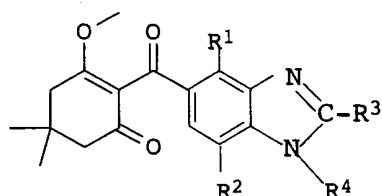
30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3f, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

35

- Tabelle 57: Verbindungen I-3g.1 bis I-3g.1363

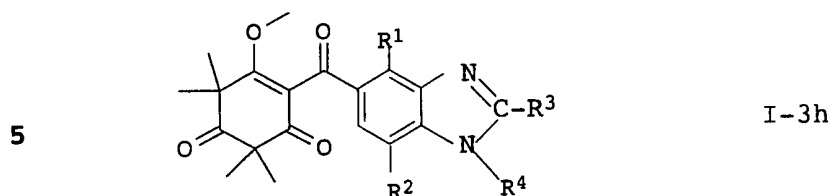
40



I-3g

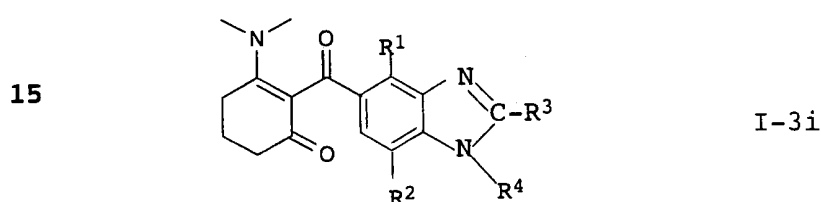
Verbindungen der allgemeinen Formel I-3g, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 58: Verbindungen I-3h.1 bis I-3h.1363



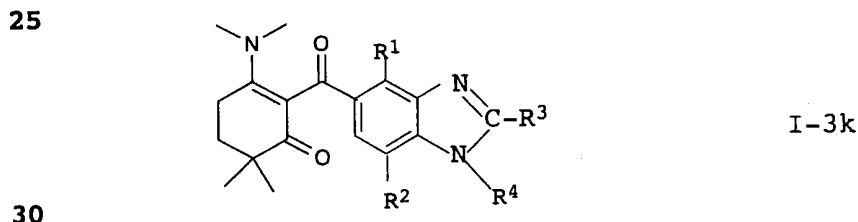
Verbindungen der allgemeinen Formel I-3h, in der die Substituen-
10 ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 59: Verbindungen I-3i.1 bis I-3i.1363



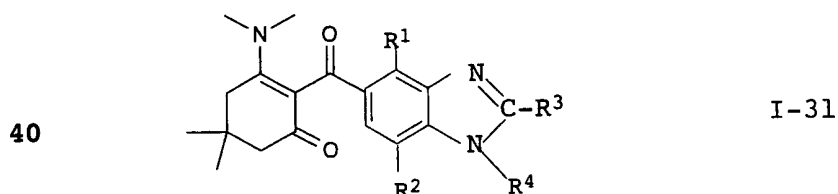
20 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3i, in der die Substituen-
ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 60: Verbindungen I-3k.1 bis I-3k.1363



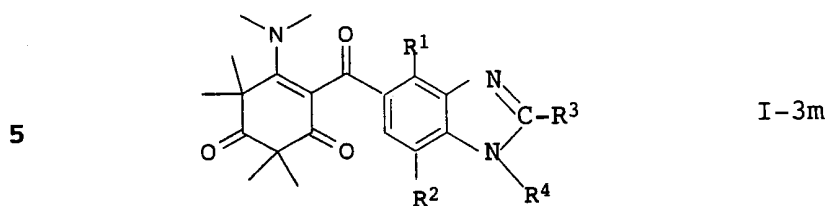
Verbindungen der allgemeinen Formel I-3k, in der die Substituen-
ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

35 - Tabelle 61: Verbindungen I-3l.1 bis I-3l.1363



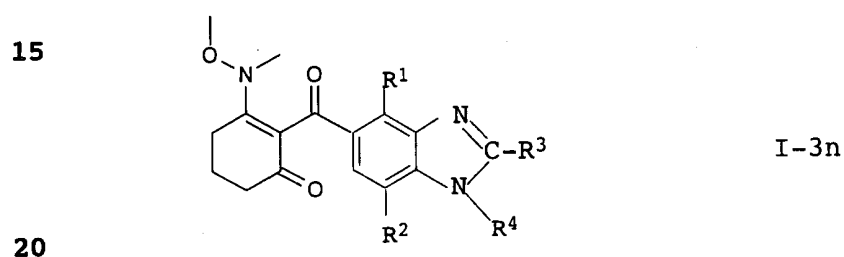
45 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3l, in der die Substituen-
ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 62: Verbindungen I-3m.1 bis I-3m.1363



Verbindungen der allgemeinen Formel I-3m, in der die Substituen-
10 ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

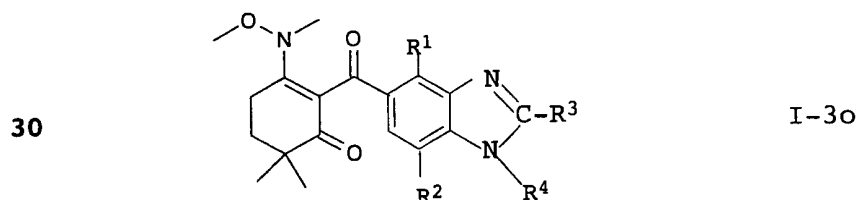
- Tabelle 63: Verbindungen I-3n.1 bis I-3n.1363



Verbindungen der allgemeinen Formel I-3n, in der die Substituen-
ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
Zeile der Tabelle B entsprechen.

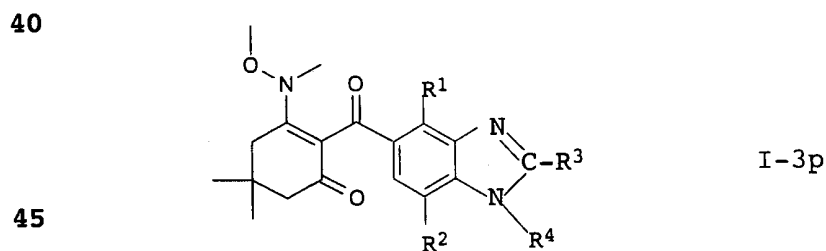
25

- Tabelle 64: Verbindungen I-3o.1 bis I-3o.1363



35 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3p, in der die Substituen-
ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
Zeile der Tabelle B entsprechen.

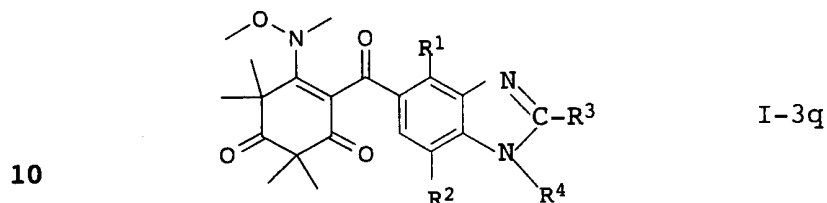
- Tabelle 65: Verbindungen I-3p.1 bis I-3p.1363



120

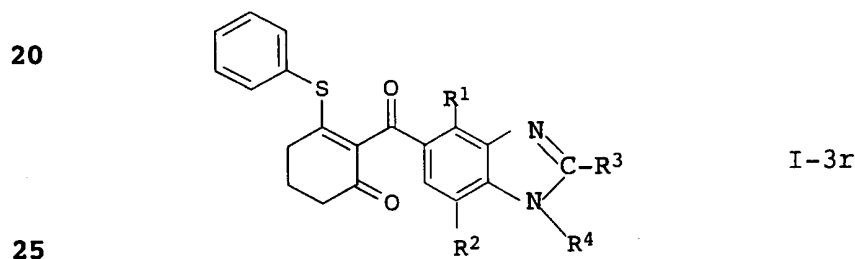
Verbindungen der allgemeinen Formel I-3p, in der die Substituenten R¹, R², R³ und R⁴ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

5 - Tabelle 66: Verbindungen I-3q.1 bis I-3q.1363



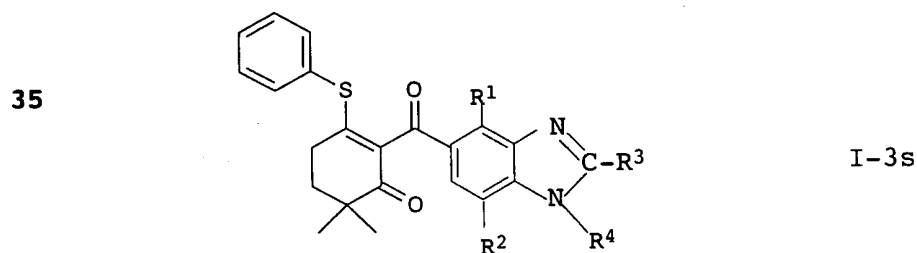
15 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3g, in der die Substituenten R¹, R², R³ und R⁴ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 67: Verbindungen I-3r.1 bis I-3r.1363



30 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3r, in der die Substituenten R¹, R², R³ und R⁴ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

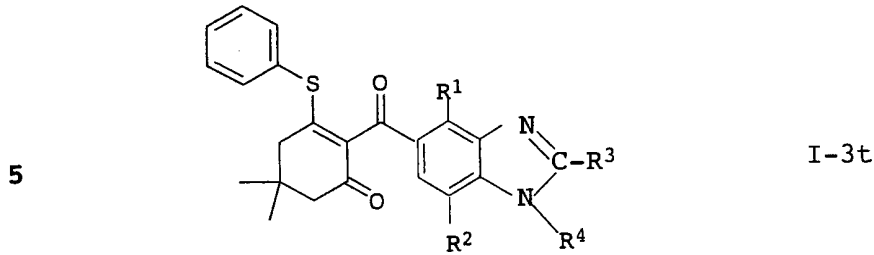
- Tabelle 68: Verbindungen I-3s.1 bis I-3s.1363



Verbindungen der allgemeinen Formel I-3s, in der die Substituenten R¹, R², R³ und R⁴ für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

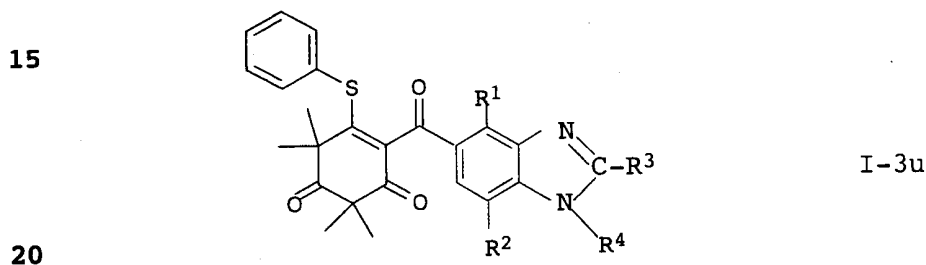
45 - Tabelle 69: Verbindungen I-3t.1 bis I-3t.1363

121



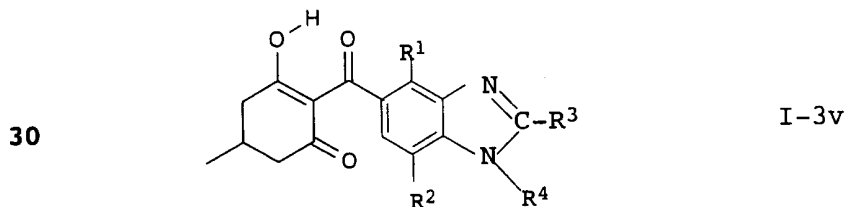
Verbindungen der allgemeinen Formel I-3t, in der die Substituen-
10 ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 70: Verbindungen I-3u.1 bis I-3u.1363



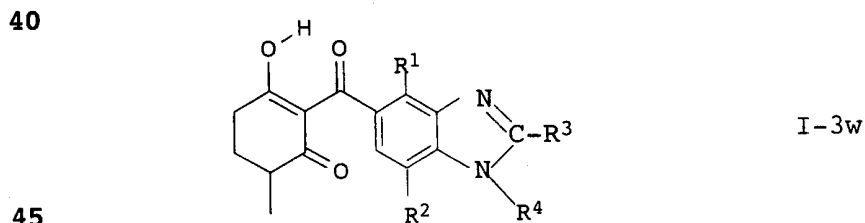
Verbindungen der allgemeinen Formel I-3u, in der die Substituen-
ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
Zeile der Tabelle B entsprechen.

25 - Tabelle 71: Verbindungen I-3v.1 bis I-3v.1363



35 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3v, in der die Substituen-
ten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer
Zeile der Tabelle B entsprechen.

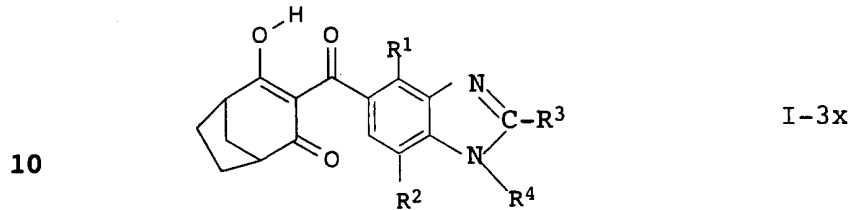
- Tabelle 72: Verbindungen I-3w.1 bis I-3w.1363



122

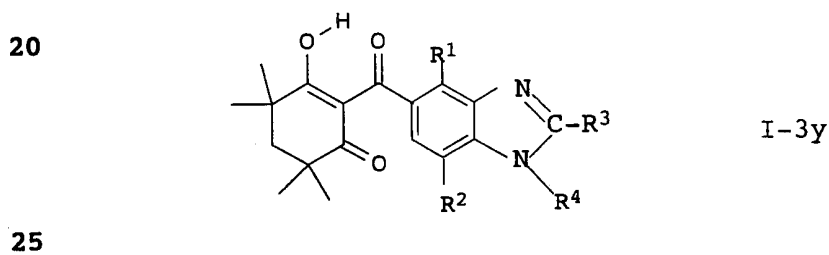
Verbindungen der allgemeinen Formel I-3w, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

5 - Tabelle 73: Verbindungen I-3x.1 bis I-3x.1363



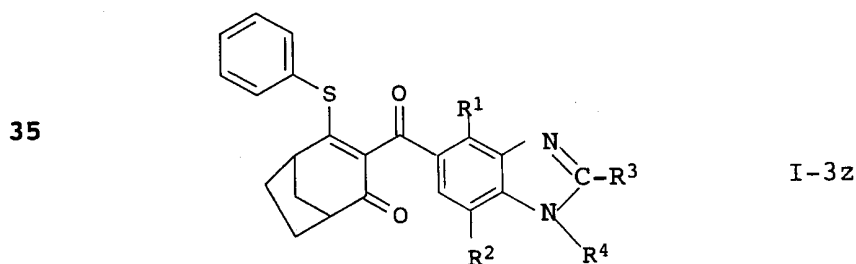
Verbindungen der allgemeinen Formel I-3x, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 74: Verbindungen I-3y.1 bis I-3y.1363



Verbindungen der allgemeinen Formel I-3y, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

30 - Tabelle 75: Verbindungen I-3z.1 bis I-3z.1363



Verbindungen der allgemeinen Formel I-3z, in der die Substituenten R^1 , R^2 , R^3 und R^4 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

45

Tabelle C

	R ¹	R ²	X	Y	
5	1	H	H	N	S
	2	CH ₃	H	N	S
	3	Cl	H	N	S
	4	OCH ₃	H	N	S
10	5	SCH ₃	H	N	S
	6	S(O) ₂ CH ₃	H	N	S
	7	H	Cl	N	S
	8	CH ₃	Cl	N	S
	9	Cl	Cl	N	S
15	10	OCH ₃	Cl	N	S
	11	SCH ₃	Cl	N	S
	12	S(O) ₂ CH ₃	Cl	N	S
	13	H	CH ₃	N	S
20	14	CH ₃	CH ₃	N	S
	15	Cl	CH ₃	N	S
	16	OCH ₃	CH ₃	N	S
	17	SCH ₃	CH ₃	N	S
25	18	S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	N	S
	19	H	H	N	NH
	20	CH ₃	H	N	NH
	21	Cl	H	N	NH
	22	OCH ₃	H	N	NH
30	23	SCH ₃	H	N	NH
	24	S(O) ₂ CH ₃	H	N	NH
	25	H	Cl	N	NH
	26	CH ₃	Cl	N	NH
35	27	Cl	Cl	N	NH
	28	OCH ₃	Cl	N	NH
	29	SCH ₃	Cl	N	NH
	30	S(O) ₂ CH ₃	Cl	N	NH
40	31	H	CH ₃	N	NH
	32	CH ₃	CH ₃	N	NH
	33	Cl	CH ₃	N	NH
	34	OCH ₃	CH ₃	N	NH
45	35	SCH ₃	CH ₃	N	NH
	36	S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	N	NH
	37	H	H	N	NCH ₃

124

	R ¹	R ²	X	Y
	CH ₃	H	N	NCH ₃
	Cl	H	N	NCH ₃
5	OCH ₃	H	N	NCH ₃
	SCH ₃	H	N	NCH ₃
	S(O) ₂ CH ₃	H	N	NCH ₃
	H	Cl	N	NCH ₃
10	CH ₃	Cl	N	NCH ₃
	Cl	Cl	N	NCH ₃
	OCH ₃	Cl	N	NCH ₃
	SCH ₃	Cl	N	NCH ₃
	S(O) ₂ CH ₃	Cl	N	NCH ₃
15	H	CH ₃	N	NCH ₃
	CH ₃	CH ₃	N	NCH ₃
	Cl	CH ₃	N	NCH ₃
	OCH ₃	CH ₃	N	NCH ₃
20	SCH ₃	CH ₃	N	NCH ₃
	S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	N	NCH ₃
	H	H	N	NC ₂ H ₅
	CH ₃	H	N	NC ₂ H ₅
25	Cl	H	N	NC ₂ H ₅
	OCH ₃	H	N	NC ₂ H ₅
	SCH ₃	H	N	NC ₂ H ₅
	S(O) ₂ CH ₃	H	N	NC ₂ H ₅
	H	Cl	N	NC ₂ H ₅
30	CH ₃	Cl	N	NC ₂ H ₅
	Cl	Cl	N	NC ₂ H ₅
	OCH ₃	Cl	N	NC ₂ H ₅
	SCH ₃	Cl	N	NC ₂ H ₅
35	S(O) ₂ CH ₃	Cl	N	NC ₂ H ₅
	H	CH ₃	N	NC ₂ H ₅
	CH ₃	CH ₃	N	NC ₂ H ₅
	Cl	CH ₃	N	NC ₂ H ₅
40	OCH ₃	CH ₃	N	NC ₂ H ₅
	SCH ₃	CH ₃	N	NC ₂ H ₅
	S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	N	NC ₂ H ₅
	H	H	N	N-i-C ₃ H ₇
45	CH ₃	H	N	N-i-C ₃ H ₇
	Cl	H	N	N-i-C ₃ H ₇
	OCH ₃	H	N	N-i-C ₃ H ₇

125

	R ¹	R ²	X	Y
	SCH ₃	H	N	N-i-C ₃ H ₇
	S(O) ₂ CH ₃	H	N	N-i-C ₃ H ₇
5	H	Cl	N	N-i-C ₃ H ₇
	CH ₃	Cl	N	N-i-C ₃ H ₇
	Cl	Cl	N	N-i-C ₃ H ₇
	OCH ₃	Cl	N	N-i-C ₃ H ₇
10	SCH ₃	Cl	N	N-i-C ₃ H ₇
	S(O) ₂ CH ₃	Cl	N	N-i-C ₃ H ₇
	H	CH ₃	N	N-i-C ₃ H ₇
	CH ₃	CH ₃	N	N-i-C ₃ H ₇
	Cl	CH ₃	N	N-i-C ₃ H ₇
15	OCH ₃	CH ₃	N	N-i-C ₃ H ₇
	SCH ₃	CH ₃	N	N-i-C ₃ H ₇
	S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	N	N-i-C ₃ H ₇

20

25

30

35

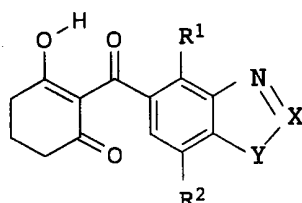
40

45

Weitere Beispiele für erfindungsgemäße bevorzugte Benzthiadiazol-5-ylcarbonyl-Derivate von Cyclohexanon (X = N, Y = S) und Benzotriazol-5-ylcarbonyl-Derivate von Cyclohexanon (X = N, Y = N-R⁴) sind die in den Tabellen 76 bis 100 genannten Verbindungen (Verbindungen I-4).

- Tabelle 76: Verbindungen I-4a.1 bis I-4a.90

10



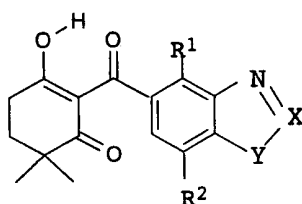
I-4a

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4a, in der die Substituenten R¹, R², X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

20 - Tabelle 77: Verbindungen I-4b.1 bis I-4b.90

25



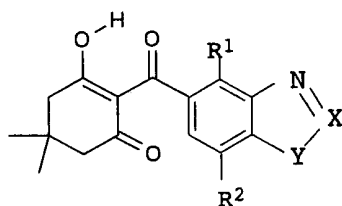
I-4b

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4b, in der die Substituenten R¹, R², X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer

30 Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 78: Verbindungen I-4c.1 bis I-4c.90

35



I-4c

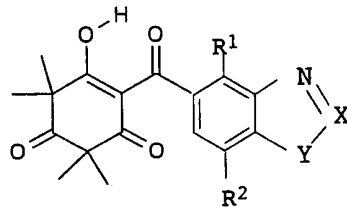
40 Verbindungen der allgemeinen Formel I-4c, in der die Substituenten R¹, R², X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 79: Verbindungen I-3d.1 bis I-3d.1363

45

127

5

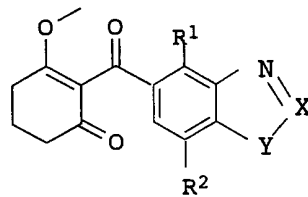


I-4d

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4d, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 80: Verbindungen I-4e.1 bis I-4e.90

15

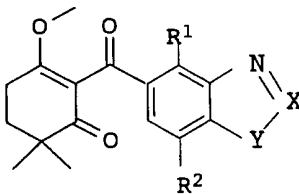


I-4e

20 Verbindungen der allgemeinen Formel I-4e, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 81: Verbindungen I-4f.1 bis I-4f.90

25



I-4f

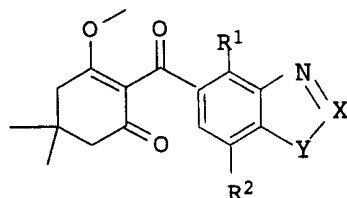
30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4f, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

35

- Tabelle 82: Verbindungen I-4g.1 bis I-4g.90

40

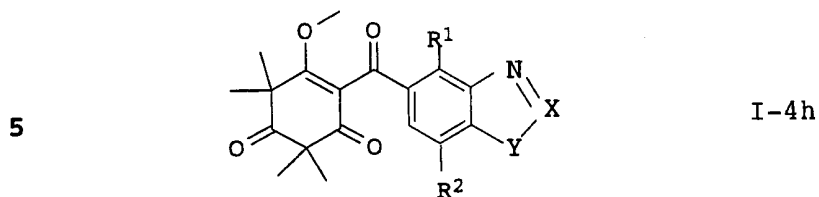


I-4g

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4g, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

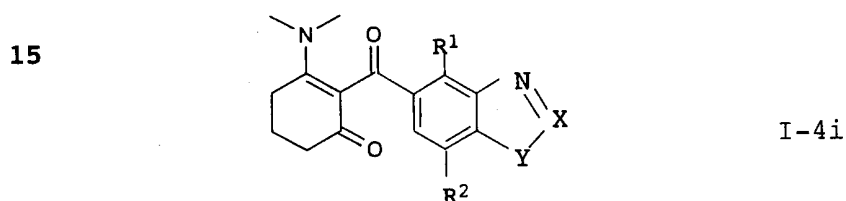
128

- Tabelle 83: Verbindungen I-4h.1 bis I-4h.90



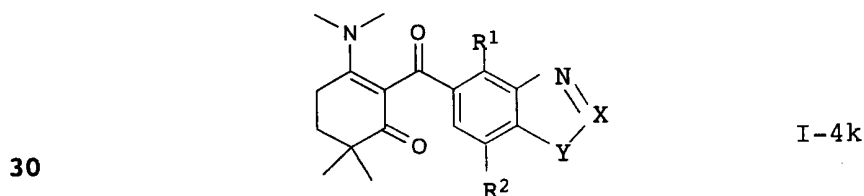
Verbindungen der allgemeinen Formel I-4h, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 84: Verbindungen I-4i.1 bis I-4i.90



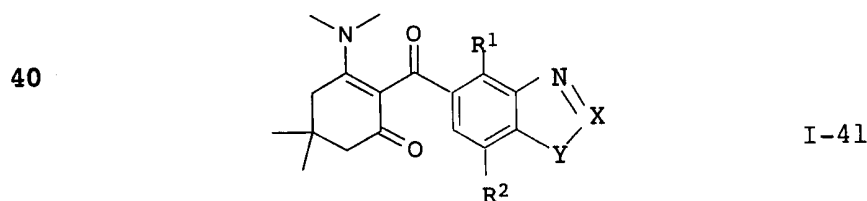
20 Verbindungen der allgemeinen Formel I-4i, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

25 - Tabelle 85: Verbindungen I-4k.1 bis I-4k.90



Verbindungen der allgemeinen Formel I-4k, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 86: Verbindungen I-4l.1 bis I-4l.90



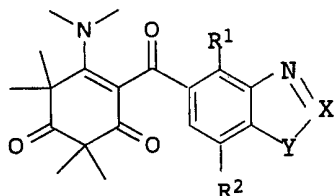
45

129

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4l, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

5 - Tabelle 87: Verbindungen I-4m.1 bis I-4m.90

10



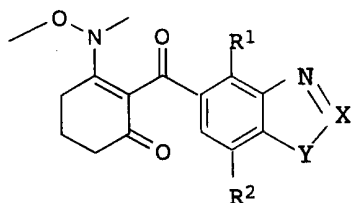
I-4m

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4m, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

15

- Tabelle 88: Verbindungen I-4n.1 bis I-4n.90

20

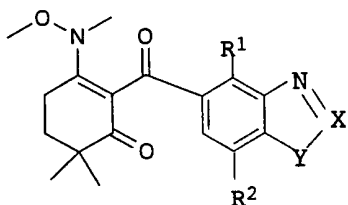


I-4n

25 Verbindungen der allgemeinen Formel I-4n, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 89: Verbindungen I-4o.1 bis I-4o.90

30



I-4o

35

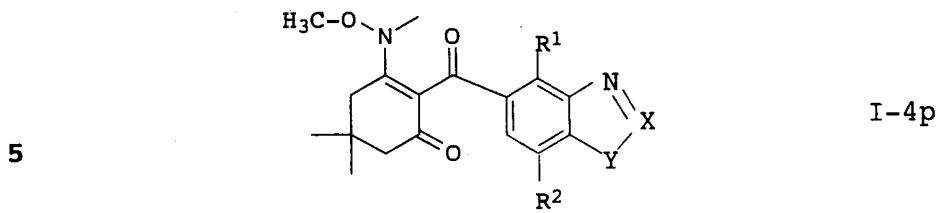
Verbindungen der allgemeinen Formel I-4o, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

40

- Tabelle 90: Verbindungen I-4p.1 bis I-4p.90

45

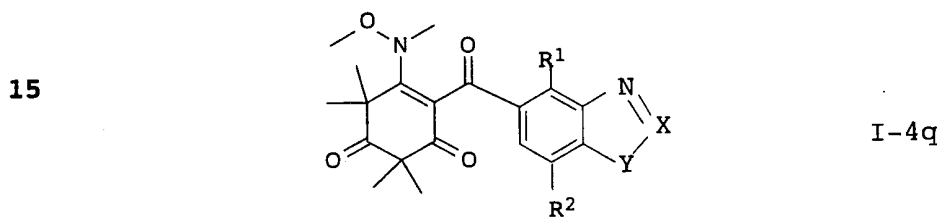
130



Verbindungen der allgemeinen Formel I-4p, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer

10 Zeile der Tabelle C entsprechen.

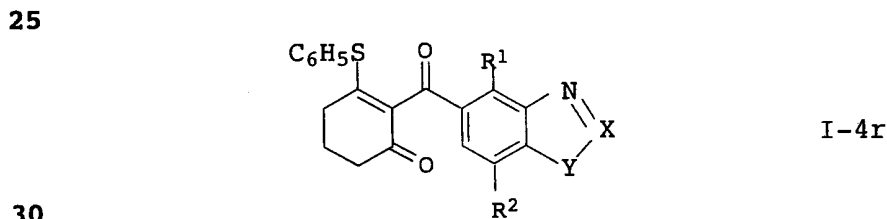
- Tabelle 91: Verbindungen I-4q.1 bis I-4q.90



20 Verbindungen der allgemeinen Formel I-4q, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer

Zeile der Tabelle C entsprechen.

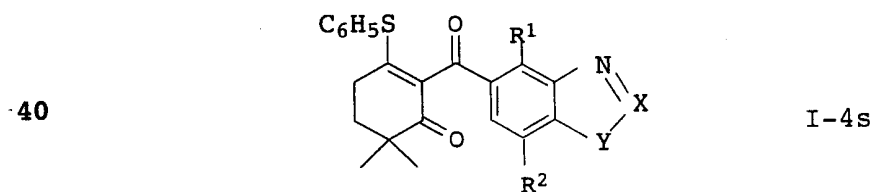
- Tabelle 92: Verbindungen I-4r.1 bis I-4r.90



Verbindungen der allgemeinen Formel I-4r, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer

Zeile der Tabelle B entsprechen.

35 - Tabelle 93: Verbindungen I-4s.1 bis I-4s.90

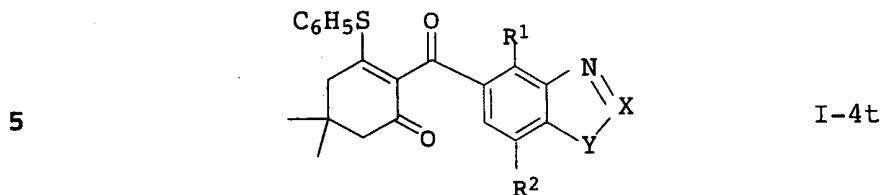


Verbindungen der allgemeinen Formel I-4s, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer

45 Zeile der Tabelle C entsprechen.

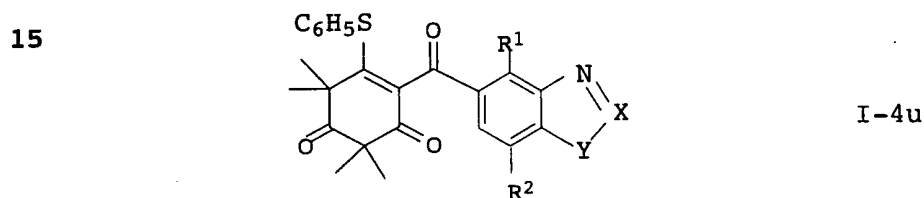
131

- Tabelle 94: Verbindungen I-4t.1 bis I-4t.90



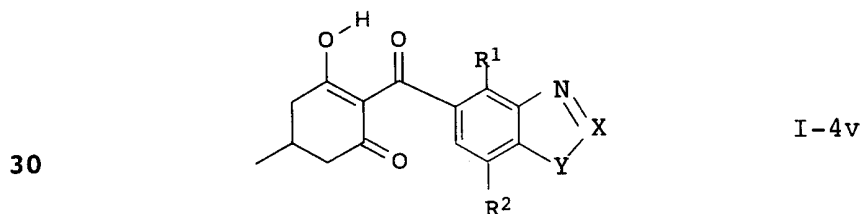
Verbindungen der allgemeinen Formel I-4t, in der die Substituen-
 10 ten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 95: Verbindungen I-4u.1 bis I-4u.90



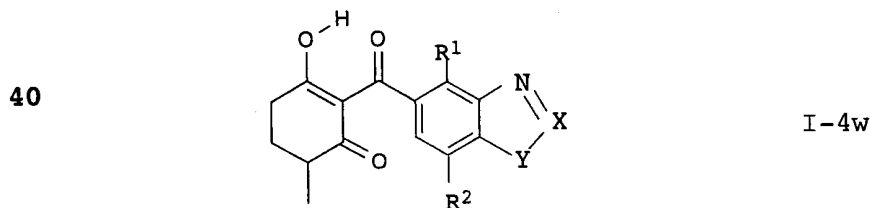
20 Verbindungen der allgemeinen Formel I-4u, in der die Substituen-
 ten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

25 - Tabelle 96: Verbindungen I-4v.1 bis I-4v.90



Verbindungen der allgemeinen Formel I-4v, in der die Substituen-
 35 ten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 97: Verbindungen I-4w.1 bis I-4w.90

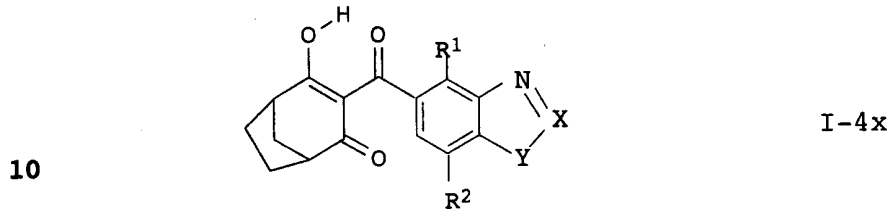


45

132

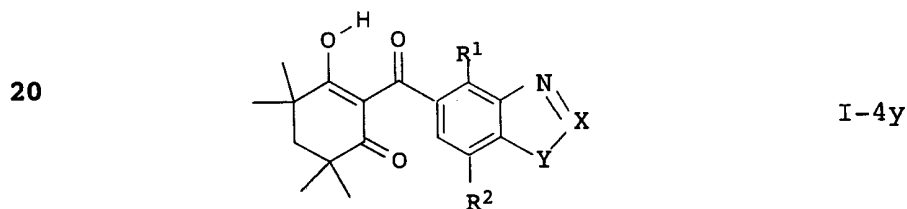
Verbindungen der allgemeinen Formel I-4w, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

5 - Tabelle 98: Verbindungen I-4x.1 bis I-4x.90



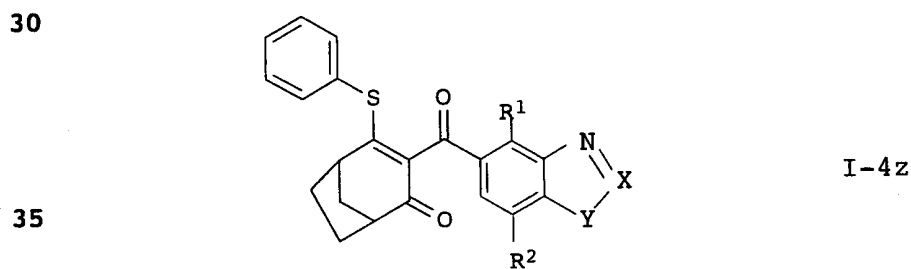
Verbindungen der allgemeinen Formel I-4x, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 99: Verbindungen I-4y.1 bis I-4y.90



25 Verbindungen der allgemeinen Formel I-4y, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 100: Verbindungen I-4z.1 bis I-4z.90



Verbindungen der allgemeinen Formel I-4z, in der die Substituenten R^1 , R^2 , X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

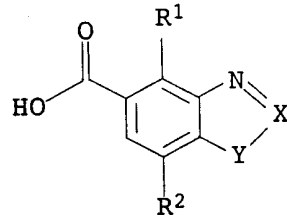
Die Darstellung von Verbindungen der Formel I, worin R^8 für Hydroxy steht, erfolgt durch Umsetzung einer aktivierten Carbonsäure IVb oder einer Carbonsäure IVa, die vorzugsweise in situ

45

133

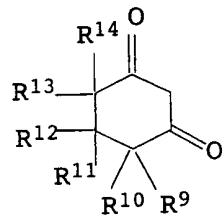
aktiviert wird, mit einem Cyclohexan-1,3-dion der Formel III zu dem Acylierungsprodukt und anschließende Umlagerung.

5



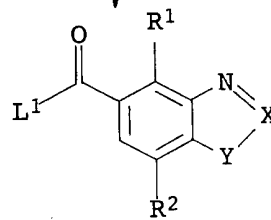
IVa

10



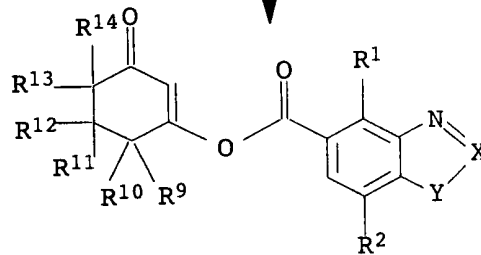
III

+



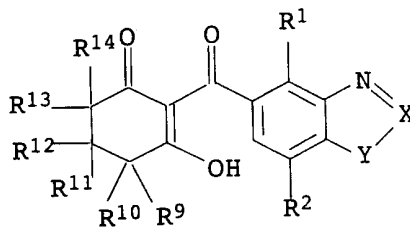
IVb

20



25

30



35

40

I (mit R⁸ = OH)

L¹ steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen z.B. Brom oder Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl oder Pyridyl, Carboxylat, z.B. Acetat oder Trifluoracetat etc.

45

134

Die aktivierte Carbonsäure IVa kann direkt eingesetzt werden, wie im Fall der Benzoylhalogenide oder in situ erzeugt werden, z.B. mit Carbodiimiden wie Ethyl-(3'-dimethylaminopropyl)carbodiimid, Dicyclohexylcarbodiimid, Triphenylphosphin/Azodicarbonsäureester, 5 2-Pyridindisulfid/Triphenylphosphin, Carbonyldiimidazol etc.

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Acylierungsreaktion in Gegenwart einer Base auszuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen 10 eingesetzt. Ein geringer Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,2 bis 1,5 Moläquivalente, bezogen auf IVa bzw. IVb, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder 15 Alkalimetallcarbonate. Als Lösungsmittel können z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid oder 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol oder Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie 20 Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid oder Ester wie Essigsäureethylester oder Gemische hiervon verwendet werden.

Werden Halogenide als aktivierte Carbonsäurekomponente eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe dieses Reaktions- 25 partners die Reaktionsmischung auf 0-10°C abzukühlen. Anschließend rührt man bei 20 - 100°C, vorzugsweise bei 25 - 50°C, bis die Umsetzung vollständig ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich hierfür be- 30 sonders Methylenchlorid, Diethylether und Essigsäureethylester. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungsmittels kann der rohe Ester ohne weitere Reinigung zur Umlagerung eingesetzt werden.

35 Die Umlagerung der Ester zu den Verbindungen der Formel I erfolgt zweckmäßigerweise bei Temperaturen von 20 bis 100°C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Base sowie gegebenenfalls mit Hilfe einer Cyanoverbindung als Katalysator.

40 Als Lösungsmittel können z.B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Dioxan, Essigsäureethylester, Toluol oder Gemische hiervon verwendet werden. Bevorzugte Lösungsmittel sind Acetonitril und Dioxan.

45 Geeignete Basen sind tertiäre Amine wie Triethylamin, aromatische Amine wie Pyridin oder Alkalicarbonat, wie Natriumcarbonat oder Kaliumcarbonat, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu

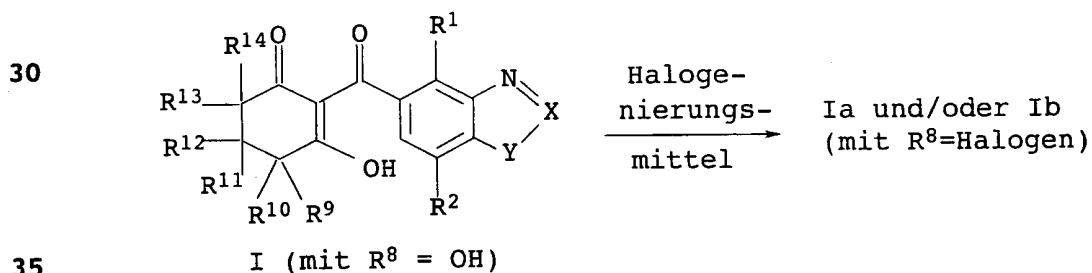
einem vierfachen Überschuß, bezogen auf den Ester, eingesetzt werden. Bevorzugt werden Triethylamin oder Alkalicarbonat verwendet, vorzugsweise in doppelt äquimolaren Verhältnis in Bezug auf den Ester.

5

Als Cyanoverbindungen kommen anorganische Cyanide, wie Natriumcyanid oder Kaliumcyanid und organische Cyanoverbindungen, wie Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid in Betracht. Sie werden in einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt. Vorzugsweise werden Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid, z.B. in einer Menge von 5 bis 15, vorzugsweise etwa 10 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen. Das Reaktionsgemisch wird z.B. mit verdünnter Mineralsäure, wie 5 %ige Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert, mit einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert. Der organische Extrakt kann mit 5–10%iger Alkalicarbonatlösung, z.B. Natriumcarbonat- oder Kaliumcarbonatlösung extrahiert werden. Die wäßrige Phase wird angesäuert und der sich bildende Niederschlag abgesaugt und/oder mit Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert, getrocknet und eingengt.

25 B. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I mit $R^8 = \text{Halogen}$ erfolgt durch Umsetzung von Cyclohexenon-Derivaten der Formel I (mit $R^8 = \text{Hydroxy}$) mit Halogenierungsmitteln:



Hier und im folgenden steht "Verbindung Ia" für eine Verbindung der allgemeinen Formel I, worin Hex für einen Rest der allgemeinen Formel IIa steht und Verbindung Ib entsprechend für eine Verbindung der allgemeinen Formel I, worin Hex für einen Rest IIb steht.

Als Halogenierungsmittel eignen sich beispielsweise Phosgen, Diphosgen, Triphosgen, Thionylchlorid, Oxalylchlorid, Phosphoroxychlorid, Phosphorpentachlorid, Mesylchlorid,

45

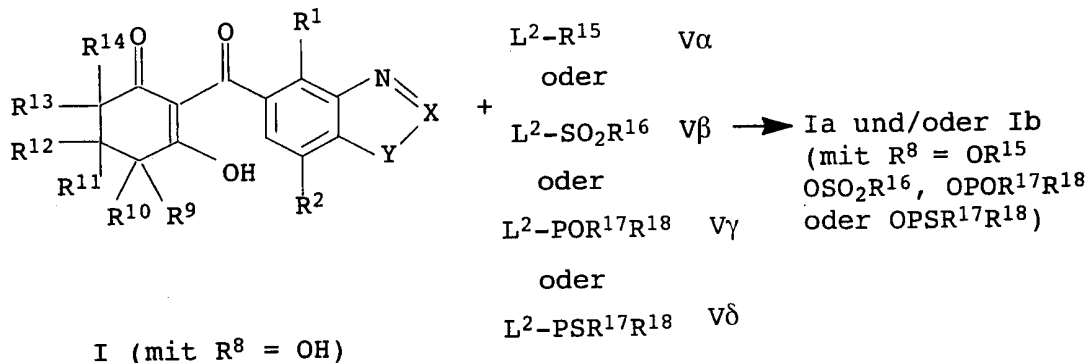
136

Chlormethylen-N,N-dimethylammoniumchlorid, Oxalylbromid,
Phosphoroxylbromid etc.

- 5 C. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I mit $R^8 = OR^{15}$,
 OSO_2R^{16} , $OPOR^{17}R^{18}$ oder $OPSR^{17}R^{18}$ durch Umsetzung von Cyclohexenon-Derivaten der Formel I (mit $R^8=Hydroxy$) mit Alkylierungs-, Sulfonylierungs- bzw. Phosphonylierungsmitteln $V\alpha$, $V\beta$, $V\gamma$ beziehungsweise $V\delta$.

10

15



20

L^2 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen, z.B. Chlor oder Brom, Hetaryl, z.B. Imidazolyl, Carboxylat, z.B. Acetat, oder Sulfonat, z.B. Mesylat oder Triflat etc.

25

Die Verbindungen der Formel $V\alpha$, $V\beta$, $V\gamma$ oder $V\delta$ können direkt eingesetzt werden wie z.B. im Fall der Carbonsäurehalogenide oder in situ erzeugt werden, z.B. aktivierte Carbonsäuren (mit Carbonsäure und Dicyclohexylcarbodiimid etc.).

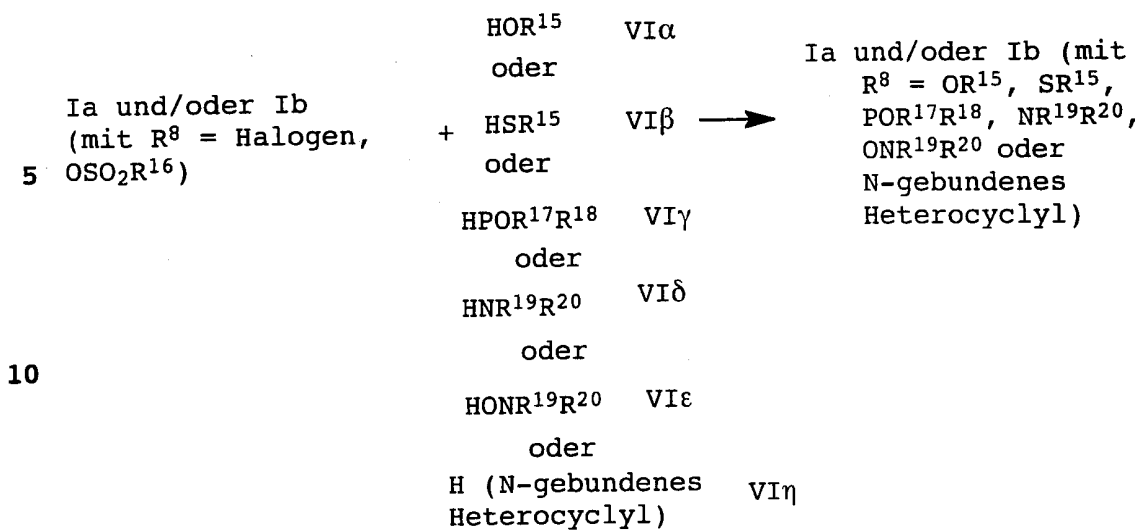
30

- 35 D. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I mit $R^8 = OR^{15}$, SR^{15} , $POR^{17}R^{18}$, $NR^{19}R^{20}$, $ONR^{19}R^{20}$ oder N-gebundenes Heterocyclyl erfolgt durch Umsetzung von Verbindungen der Formel I mit $R^8 =$ Halogen, OSO_2R^{16} mit Verbindungen der Formel $VI\alpha$, $VI\beta$, $VI\gamma$, $VI\delta$, $VI\epsilon$ oder $VI\eta$, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base oder unter vorangehender Salzbildung.

40

45

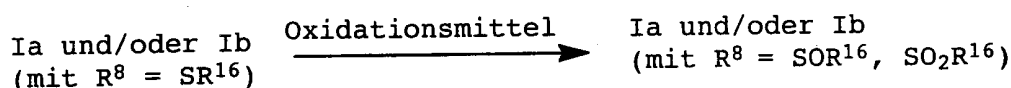
137



15

E. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I mit $R^8 = \text{SOR}^{16}, \text{SO}_2R^{16}$ erfolgt beispielsweise durch Umsetzung von Verbindungen der Formel I mit $R^8 = \text{SR}^{16}$ mit einem Oxidationsmittel.

20



25

Als Oxidationsmittel kommen beispielsweise m-Chlorperbenzoesäure, Peroxyessigsäure, Trifluorperoxyessigsäure, Wasserstoffperoxid, ggf. in Gegenwart eines Katalysators wie Wolframat, in Betracht.

30 Für die unter den Punkten B bis E genannten Reaktionen gelten folgende Bedingungen:

Die Ausgangsverbindungen werden in der Regel im äquimolaren Verhältnis eingesetzt. Es kann aber auch von Vorteil sein, die

35 eine oder andere Komponente im Überschuß einzusetzen.

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzungen in Gegenwart einer Base durchzuführen. Die Reaktanden und die Base werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt.

40

Im Hinblick auf die Verfahren C und D kann es unter Umständen vorteilhaft sein, ein Überschuß der Base z.B. 1,5 bis 3 Moläquivalente jeweils bezogen auf das Edukt einzusetzen.

45 Als Basen eignen sich tertiäre Alkylamine, wie Triethylamin, aromatische Amine, wie Pyridin, Alkalimetallcarbonate, z.B. Natriumcarbonat oder Kaliumcarbonat, Alkalimetallhydrogencarbonate, wie

138

Natriumhydrogencarbonat und Kaliumhydrogencarbonat, Alkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kalium-tert.-butanolat oder Alkalimetallhydride, z.B. Natriumhydrid. Bevorzugt verwendet werden Triethylamin oder Pyridin.

5

Als Lösungsmittel kommen z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid oder 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol oder Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan,

10 polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid oder Ester, wie Essigsäureethylester, oder Gemische hiervon in Betracht.

In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0°C bis
15 zur Höhe des Siedepunktes des Reaktionsgemisches.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise zum Produkt hin erfolgen.

20 In Abhängigkeit von den Reaktionsbedingungen können bei den Verfahren B bis D die Verbindungen Ia, Ib oder Gemische hiervon gebildet werden. Letztere können durch klassische Trennmethode, wie z.B. Kristallisation, Chromatographie etc., getrennt werden.

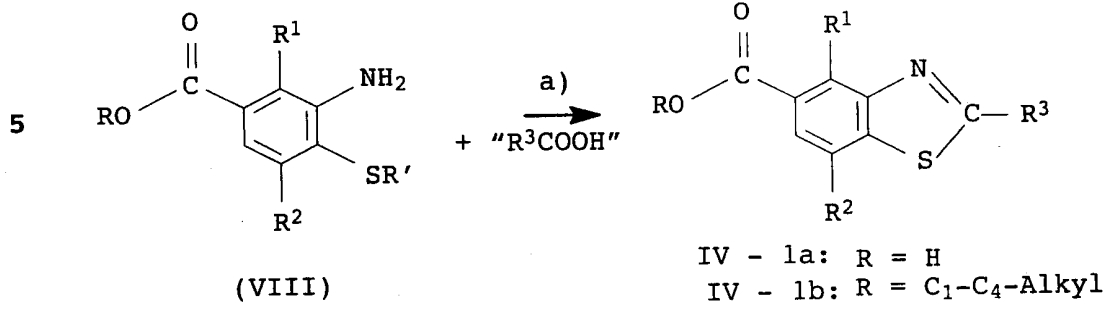
25 Die als Ausgangsmaterialien verwendeten Cyclohexandione der Formel IV sind bekannt oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (z.B. EP-A 71 707, EP-A 142 741, EP-A 243 313, US 4,249,937, WO 92/13821).

30 Die Alkylierungsmittel V α , Sulfonylierungsmittel V β , Phosphonylierungsmittel V γ beziehungsweise V δ , sowie die Verbindungen VI α , VI β , VI γ , VI δ und VI ϵ sind ebenfalls bekannt oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden.

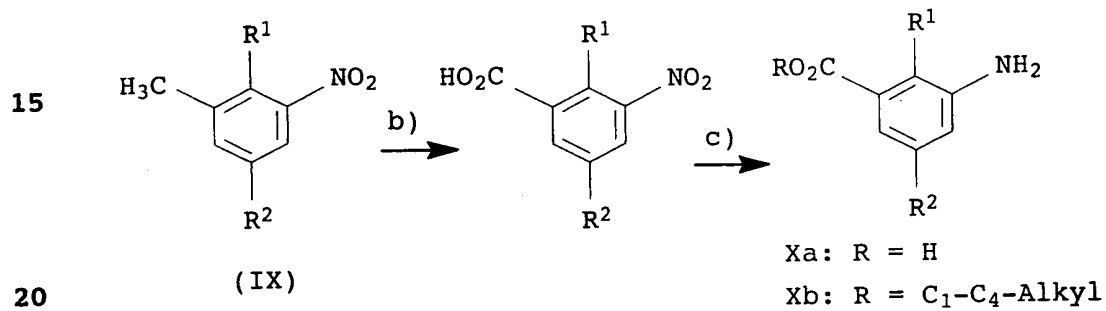
35 Die Carbonsäuren der allgemeinen Formel IVa beziehungsweise ihre aktivierten Derivate IVb sind entweder aus der Literatur bekannt oder lassen sich in Analogie zu bekannten Verfahren herstellen.

In Schema 1 ist ein üblicher Zugang zu Benzothiazol-5-carbonsäuren
40 (Verbindungen IV-1) dargestellt.

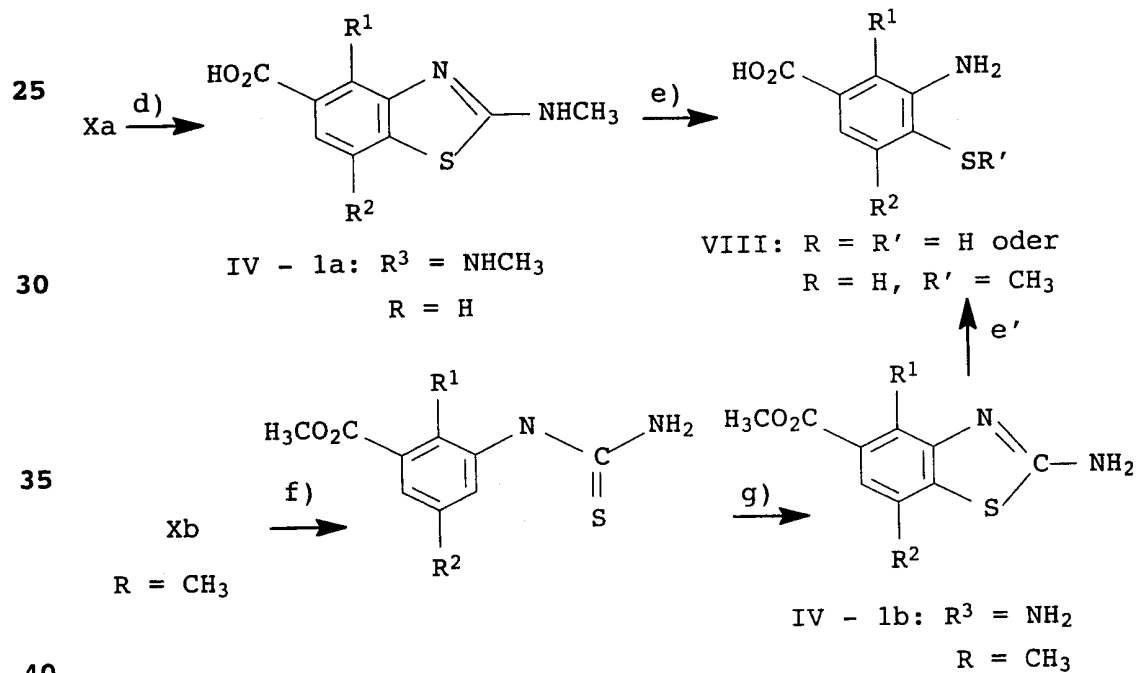
Schema 1



10



20



In der Formel IV-1 steht R für Wasserstoff (Verbindung IV-1a) oder einen verseifbaren Kohlenwasserstoffrest, z.B. für Methyl (Verbindung IV-1b). Verbindungen der allgemeinen Formel IV-1 lassen sich beispielsweise gemäß Reaktionsschritt a) durch Kondensation von ortho-Aminothiophenolen der allgemeinen Formel VIII (R' = H) oder von ortho-Aminothioethern der allgemeinen Formel

45

140

VIII (R = C₁-C₄-Alkyl, z.B. Methyl) mit einem Carbonsäureäquivalent "R³-CO₂H" also einer Carbonsäure R³CO₂H oder aktivierten Derivaten R³COL¹, R³C(L³)₃ davon, worin L¹ für eine reaktive Abgangsgruppe steht und L³ für eine C₁-C₄-Alkoxygruppe steht, herstellen.

5 Beispiele für L¹ sind Chlor, Brom, Carboxylat, wie Acetat, Trifluoroacetat, N-Heterocyclyl, wie Imidazolyl, Pyridyl etc. Beispiele für R³COL¹ und R³C(L³)₃ sind die Säurehalogenide, Carbonsäureester und Carbonsäureanhydride sowie die Orthoester der Carbonsäuren R³CO₂H.

10

Die Kondensationsreaktion a) erfolgt vorzugsweise unter neutralen bis sauren Reaktionsbedingungen, vorzugsweise in Gegenwart einer anorganischen oder organischen Säure, wie beispielsweise Salzsäure, Schwefelsäure, p-Toluolsulfonsäure und Pyridinium-p-tolu-

15 olsulfonat in einem organischen Lösungsmittel bei Temperaturen im Bereich von 0 bis 150°C und vorzugsweise im Bereich von 20 bis 120°C. Als Lösungsmittel kommen insbesondere gesättigte Kohlenwasserstoffe, halogenierte Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, aliphatische Ether wie Diethylether und
20 tert-Butyl-methylether oder Pyridin in Betracht. Zur Herstellung von Bezothiazolen aus o-Aminothiophenolen beziehungsweise entsprechenden Thiomethylethern siehe auch Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. E 8b, S.869-871.

25 Schritt a) kann auch zweistufig durchgeführt werden, wobei zunächst die Aminofunktion in VIII mit einer Carbonsäure R⁹-COOH oder einem Derivat davon zum Carbonsäureamid umgesetzt wird, das anschließend zum Benzothiazol der allgemeinen Formel IV-1 cyclisiert wird.

30

Die Umsetzung zum Amid gelingt unter den für die Amidbildung üblichen Bedingungen, beispielsweise durch Umsetzung einer Säure in Gegenwart eines wasserbindenden Mittels. Die Cyclisierung gelingt mit Lewissäuren oder Phosgen. Die Cyclisierung wird dann vorzugs-

35 weise in einem inerten organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem aliphatischen oder aromatischen Kohlenwasserstoff oder in einem Halogenkohlenwasserstoff durchgeführt.

Ortho-Aminothiophenole der allgemeinen Formel VIII (R' = H) können gemäß Schema 1 ausgehend von 3-Nitrotoluolen der allgemeinen
40 Formel IX hergestellt werden. Hierin kann die Methylgruppe in bekannter Weise katalytisch oder stöchiometrisch zur Carbonsäure oxidiert werden (Schritt b). Als Oxidationsmittel können beispielsweise Metalloxide von Übergangsmetallen, beispielsweise
45 Mangandioxid, Chromtrioxid sowie deren anionische Komplexsalze, z.B. Natriumdichromat oder Chromylchlorid, Pyridiniumchromat, weiterhin oxidierende Säuren, beispielsweise HNO₃, oxidierende

141

Gase wie Sauerstoff oder Chlor, gegebenenfalls in Anwesenheit von Übergangsmetallen (beziehungsweise der Salze, z.B. der Oxide oder Chloride) als Katalysatoren eingesetzt werden. Je nach Löslichkeit der zu oxidierenden Verbindung und abhängig von dem verwendeten Oxidationsmittel arbeitet man vorzugsweise in wässrigen Lösungen, einphasigen Systemen aus Wasser und mit Wasser mischbaren organischen Lösungsmitteln oder in mehrphasigen Systemen aus Wasser und organischen Lösungsmitteln unter Phasentransferkatalyse. Abhängig vom gewählten Oxidationsmittel wird man die Oxidation in der Regel bei Temperaturen im Bereich von -15 bis +150°C und vorzugsweise im Bereich von 0 bis 100°C durchführen. Zur Oxidation von aromatischen Methylgruppen zu Benzoensäuren siehe beispielsweise (Houben-Weyl: "Methoden der organischen Chemie", V. Band, IV/1a 1981; Bd. VIII 1952; E. Bengtsson, Acta Chem. Scand. 1953, 7, 774; Singer et al. Org. Synth. Coll. Vol III, 1955, 740; B.A.S. Hay et al. Can. J. Chem. 1965, 43, 1306)

Die so erhaltenen 3-Nitro-benzoensäurederivate werden anschließend in Schritt c) zu den 3-Aminobenzoensäuren reduziert. Die selektive Reduktion von aromatischen Nitrogruppen in Anwesenheit von Carbonsäuregruppen ist grundsätzlich bekannt. Als Reduktionsmittel kommen beispielsweise Hydrazine, Metallhydride wie Aluminiumhydrid, und davon abgeleitete Komplexverbindungen wie Lithiumaluminiumhydrid, Diisobutylaluminiumhydrid, oder Borane in Betracht. Bevorzugtes Reduktionsmittel ist Wasserstoff in Gegenwart von katalytischen Mengen an Übergangsmetallen beispielsweise Ni, Pd, Pt, Ru oder Rh, die in geträgerter Form, beispielsweise auf Aktivkohle, in Form aktivierter Metalle, z.B. Raney-Nickel, oder in Form löslicher Komplexverbindungen eingesetzt werden können. Geeignete Lösungsmittel für die Reduktion sind abhängig von der Löslichkeit des zu hydrierenden Substrates und dem gewählten Reduktionsmittel C₁-C₄-Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol oder n-Butanol, halogenierte C₁-C₆-Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Trichlormethan, Trichlorethan, Trichlorethylen, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol, Xylole, Chlorbenzol, wässrige Lösungen anorganischer oder organischer Säuren, wie wässrige Salzsäure. Üblicherweise erfolgt die Reduktion bei Temperaturen im Bereich von -15 bis +100°C, vorzugsweise im Bereich von 0 bis 40°C. Die Reduktion mit Wasserstoff erfolgt üblicherweise bei einem Wasserstoffdruck im Bereich von 1 bis 50 bar, vorzugsweise im Bereich von 1 bis 10 bar. Zur katalytischen Hydrierung aromatischer Nitrogruppen siehe beispielsweise Rylander in "Catalytic Hydrogenation over Platinum Metals", Academic Press, New York, 1967, 168-202; Furst et al., Chem. Rev. 1965, 65, 52; Tepko et al., J. Org. Chem. 1980, 45, 4992.

142

Die so erhaltenen o-Aminobenzoesäuren der allgemeinen Formel Xa (R = H) werden dann in einem weiteren Reaktionsschritt d) mit einem organischen Isothiocyanat (in Schema 1 Methylisothiocyanat) zu einem substituierten Thioharnstoffderivat umgesetzt, das ohne weitere Isolierung oxidativ zur Benzothiazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IX-1a (in Schema 1 mit R³ = NH-CH₃) cyclisiert wird.

- Der erste Reaktionsschritt in Stufe d), nämlich die Umsetzung der m-Aminobenzoesäure der allgemeinen Formel Xa zum substituierten Harnstoff erfolgt durch Umsetzung mit einem C₁-C₆-Alkylisothiocyanat oder einem gegebenenfalls substituierten Phenylisothiocyanat in einem wasserfreien, organischen Lösungsmittel bei Temperaturen im Bereich von -15°C bis 150°C und vorzugsweise im Bereich von -15°C bis 100°C. Geeignete Lösungsmittel sind beispielsweise aliphatische oder cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe, wie n-Hexan oder Cyclohexan, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Trichlormethan, Trichlorethan, Trichlorethylen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol oder Anisol, Dialkylether oder cyclische Ether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, wasserfreie Carbonsäuren wie Eisessig oder in Pyridin. Zur Herstellung substituiertes Thioharnstoffe siehe beispielsweise: Kurzer, F., Org. Synth. 1951, 31, 21; R.R. Gupta et al., Synth. Commun. 17(2), 229-240 (1987); Rathke, Ber. Dtsch. Chem. Ges. 1885, 18, 3102; Schiff, Justus Liebigs Ann. Chem., 1868, 148, 338; Frank, R.L., Smith, P.V.; Org. Synth. 1955, III, 735, N.B. Ambati et al., Synth. Commun. 1997, 27 (9), 1487-1493; W.O. Foye, J. Pharm. Sci., 1977, 66, No. 7, 923-926.
- Das so erhaltene, substituierte Thioharnstoff-Derivat wird dann in einem zweitem Reaktionsschritt von Schritt d) mit einem halogenhaltigen Oxidationsmittel wie Brom, Sulfurylchlorid oder Chlor in einem inerten organischen Lösungsmittel zur substituierten 2-Aminobenzothiazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IV-1a (in Schema 1 steht R³ für NH-CH₃) cyclisiert. Die Cyclisierung erfolgt in der Regel bei Temperaturen im Bereich von -15 bis +150°C und vorzugsweise im Bereich von 0 bis 120°C. Geeignete Lösungsmittel sind insbesondere die vorgenannten aliphatischen oder cycloaliphatischen Kohlenwasserstoffe, die vorgenannten aromatischen Kohlenwasserstoffe, die vorgenannten wasserfreien Carbonsäuren, ferner C₁-C₄-Alkanole, z.B. Methanol, Ethanol oder Isopropanol, Dialkylether, cyclische Ether und Mischungen der vorgenannten Lösungsmittel. Zur oxidativen Cyclisierung substituiertes Thioharnstoffe zu Benzothiazolen siehe beispielsweise Houben-Weyl: "Methoden der organischen Chemie V, Bd.E8B, 1994, S.865 f.

143

Die substituierte 2-Aminobenzothiazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IV-1a kann direkt mit einem Cyclohexan-1,3-dion der allgemeinen Formel III oder einem aktivierten Derivat davon in der oben beschriebenen Weise zur erfindungsgemäßen Verbindung I 5 (mit $Y = S$ und $X = C-NH-R''$, wobei R'' für C_1-C_6 -Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht) umgesetzt werden.

Sofern R^3 in Formel IV-1a für $NH-CH_3$ steht, können durch Hydrolyse gemäß Schritt e) auch die o-Aminothiobenzoesäuren der allgemeinen Formel VIII (mit $R = R' = H$) hergestellt werden. Der Hydrolyse 10 folgt in der Regel noch die Methylierung zum Methylthioether VIII ($R = H$, $R' = CH_3$). Die Hydrolyse in Schritt e) erfolgt beispielsweise durch Umsetzung der Verbindung IV-1a (mit $R^3 = NH-CH_3$) mit einem Alkalihydroxid, z.B. Lithium-, Natrium- oder Kaliumhydro- 15 xid, einem Erdalkalihydroxid oder Alkaliiodiden, wie Natriumiodid in einem geeigneten Lösungsmittel bei erhöhter Temperatur, wobei vorzugsweise in Abwesenheit von Sauerstoff gearbeitet wird. Übliche Reaktionstemperaturen liegen im Bereich von 0 bis $200^\circ C$, insbesondere im Bereich von 20 bis $180^\circ C$. Geeignete Lösungsmittel 20 sind neben den vorgenannten aliphatischen oder cycloaliphatischen Kohlenwasserstoffen, den halogenierten Kohlenwasserstoffen, den aromatischen Kohlenwasserstoffen, den vorgenannten Ethern und Alkoholen insbesondere wässrige, einphasige Systeme und Pyridin. Zur Verseifung der substituierten 2-Aminobenzothiazol-5-carbon- 25 säuren siehe beispielsweise: Organikum, 16. Aufl. 1986, S. 415; Mc Murry, Org. React. 1976, 24, 187; Taschner et al., Roczn. Chem. 1956, 30, 323; z.B. Houben-Weyl: "Methoden der organischen Chemie", Band E8b, 1994; S.1010 f.; J. Chem. Soc. Perkin Trans., Part 1, 1976, No. 12, 1291-1296, insbesondere A.R. Katritzky et 30 al., J. Heterocycl. Chem. 30 (1) 135-139, 1993. Die Umsetzung zum Methylthioether VIII mit $R = H$ und $R' = CH_3$ gelingt in einfacher Weise durch Umsetzung mit Methyljodid oder Dimethylsulfat.

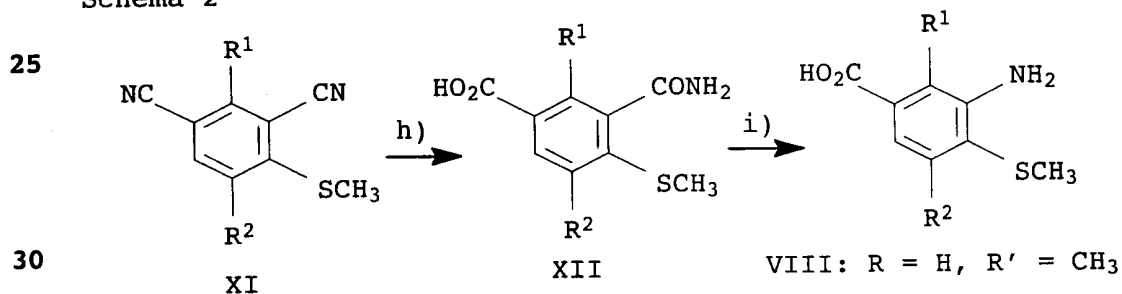
In ähnlicher Weise können Verbindungen der allgemeinen Formel 35 VIII mit $R = H$ erhalten werden, wenn man zunächst die 3-Aminobenzoesäure der allgemeinen Formel Xa mit einem C_1-C_4 -Alkanol, z.B. mit Methanol in bekannter Weise verestert. Der so erhaltene Ester der allgemeinen Formel Xb ($R = C_1-C_4$ -Alkyl, insbesondere Methyl) wird dann in Schritt f) mit Isothiocyansäure oder einem geeigneten Salz der Isothiocyansäure, z.B. Natriumrhodanid in Gegenwart 40 einer konzentrierten Mineralsäure, zum Thioharnstoff-Derivat umgesetzt. Die Reaktionsbedingungen entsprechen dem unter Schritt d) für die Harnstoffderivate angegebenen Reaktionsbedingungen. Das Thioharnstoffderivat wird anschließend in Schritt g) unter 45 den oben genannten Bedingungen zum 2-Aminobenzothiazol-5-carbonsäureester der allgemeinen Formel IV-1b ($R^3 = NH_2$) cyclisiert. Die so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel IV-1b mit $R^3 = NH_2$

144

kann entweder in Schritt e' zur Verbindung VIII hydrolysiert und gegebenenfalls anschließend methyliert werden (VIII: R = H, R' = CH₃) werden.

- 5 Sie kann auch in der oben beschriebenen Weise zur erfindungsgemäßen Verbindung I (mit X = C-NH₂ und Y = S) umgesetzt werden. Zudem besteht die Möglichkeit, die 2-Aminogruppe der Verbindung IV-1b zunächst zu diazotieren und auf diesem Wege weitere Funktionalitäten in die 2-Position des Benzothiazolgerüsts einzuführen.
- 10 Umwandlung von R³ = NH₂ in R³ = Halogen gelingt in bekannter Weise unter Sandmeyer-Bedingungen. Die Umwandlung von R³ = NH₂ in R³ = H gelingt in bekannter Weise durch sukzessive Umsetzung des 2-Aminobenzothiazol-5-carbonsäureesters mit Nitrit unter sauren Bedingungen und anschließend einem Reduktionsmittel wie Hypophosphoriger Säure, Natriumborhydrid, Trialkylsilane, Trialkylstannane,
- 15 SnCl₂, NO, Wilkinsonkatalysatoren; siehe auch J. Am. Chem. Soc. 1949, 71, S.2137; J. Am. Chem. Soc. 1950, 72, S.3013; 1954, Bd.76, S.290.
- 20 Ein weiterer Zugang zu Verbindungen der allgemeinen Formel VIII wird in Schema 2 aufgezeigt.

Schema 2

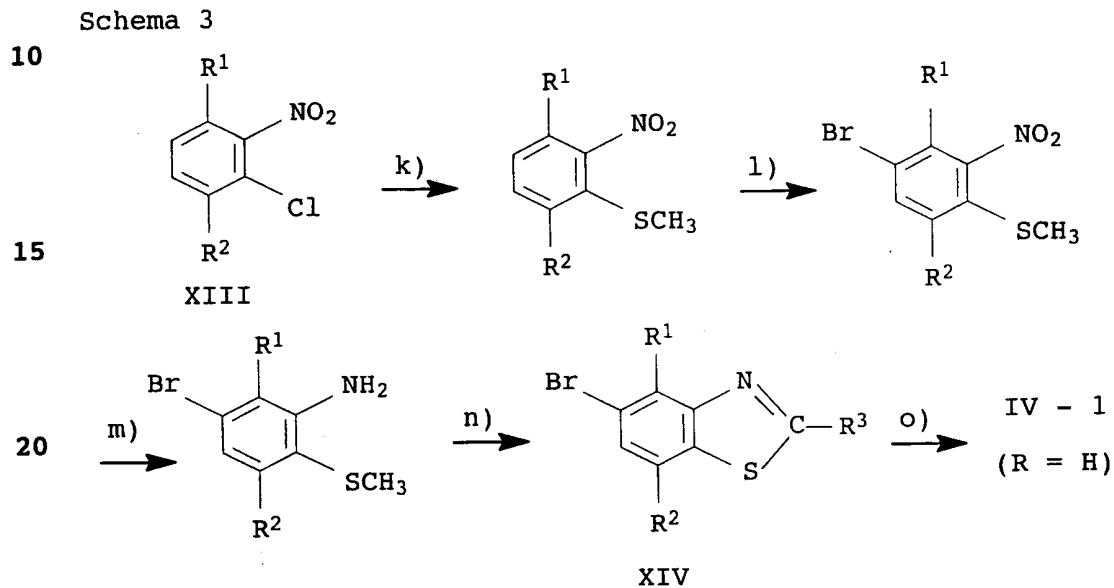


- Ausgehend von 2,4-Dicyanothioanisolen der allgemeinen Formel XI wird durch selektive Hydrolyse im Schritt h) das Amid der allgemeinen Formel XII hergestellt. Aufgrund der unterschiedlichen
- 35 Reaktivität der beiden Methylgruppen gelingt die Darstellung unter üblichen, alkalischen Verseifungsbedingungen, wobei man vorzugsweise das Fortschreiten der Reaktion kontrolliert. Verfahren zur alkalischen Verseifung von Nitrilen sind beispielsweise aus
- 40 Org. Synth. Col. Vol 1, 1941, S. 321 bekannt. In einem weiteren Schritt i) wird dann die Amidfunktion in den Verbindungen der allgemeinen Formel XII im Sinne eines Hofmann-Abbaus in eine Aminofunktion umgewandelt. Hierbei werden Verbindungen der allgemeinen Formel VIII mit R=H und R'=CH₃ erhalten. Typische Bedingungen
- 45 für den Hofmann-Abbau sind: wässrig alkalische Chlor- oder Hypochloridlösungen, Temperaturen im Bereich von 0 bis 150°C und

145

vorzugsweise im Bereich von 20 bis 120°C (siehe auch Organikum 16. Auflage 1986, S. 572).

Ein weiterer Zugang zu Benzothiazol-5-carbonsäuren wird in Schema 3 gezeigt. Dieser Zugang macht von der Umwandlung von Benzothiazolen der allgemeinen Formel XIV in entsprechende Carbonsäuren gemäß Reaktionsschritt o) Gebrauch.



Die Umwandlung des Brombenzothiazols der allgemeinen Formel XIV in die Carbonsäure der allgemeinen Formel IV-1 (R=H) gelingt beispielsweise durch sukzessive Umsetzung von XIV mit Magnesium zur entsprechenden Grignard-Verbindung und anschließender Umsetzung der Grignard-Verbindung mit Kohlendioxid. Alternativ kann die Verbindung XIV durch Halogen-Metallaustausch mit einem Alkalimetallalkyl, z.B. einem Lithiumalkyl, wie Methyllithium, n-Butyllithium oder tert-Butyllithium, und anschließende Umsetzung des Reaktionsproduktes mit CO₂ in die Verbindung IV-1 überführt werden.

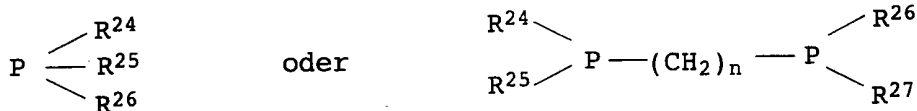
Reaktionsschritt o) in Schema 3 kann auch durch Umsetzung des 5-Brombenzothiazols der allgemeinen Formel XIV mit Kohlenmonoxid, einer Base und Wasser unter erhöhtem Druck in Gegenwart eines Pd-, Ni-, Co- oder Rh-Katalysators realisiert werden.

Die Katalysatoren Nickel, Cobalt, Rhodium und insbesondere Palladium können metallisch oder in Form üblicher Salze wie in Form von Halogenverbindungen, z.B. PdCl₂, RhCl₃·H₂O, Acetaten, z.B. Pd(OAc)₂, Cyaniden usw. in den bekannten Wertigkeitsstufen vorliegen. Ferner können Metallkomplexe mit tertiären Phosphinen, Metallalkylcarbonyle, Metallcarbonyle, z.B. CO₂(CO)₈, Ni(CO)₄, Metallcarbonyl-Komplexe mit tertiären Phosphinen, z.B.

146

(PPh₃)₂Ni(CO)₂, oder mit tertiären Phosphinen komplexierte Übergangsmetallsalze vorliegen. Die letztgenannte Ausführungsform ist insbesondere im Fall von Palladium als Katalysator bevorzugt. Dabei ist die Art der Phosphinliganden breit variabel. Beispiels-

5 weise lassen sie sich durch folgende Formeln wiedergeben:



- 10 wobei n die Zahlen 1, 2, 3 oder 4 bedeutet und die Reste R²⁴ bis R²⁶ für niedermolekulares Alkyl, z.B. C₁-C₆-Alkyl, Aryl, C₁-C₄-Alkylaryl, z.B. Benzyl, Phenethyl oder Aryloxy stehen. Aryl ist z.B. Naphthyl, Anthryl und vorzugsweise gegebenenfalls substituier-
 15 nur auf deren Inertheit gegenüber der Carboxylierungsreaktion zu achten hat, ansonsten können sie breit variiert werden und umfassen alle inerten C-organischen Reste wie C₁-C₆-Alkylreste, z.B. Methyl, Carboxylreste wie COOH, COOM (M ist z.B. ein Alkali-, Erdalkalimetall oder Ammoniumsalz), oder C-organische
 20 Reste über Sauerstoff gebunden wie C₁-C₆-Alkoxyreste.

Die Herstellung der Phosphinkomplexe kann in an sich bekannter Weise, z.B. wie in den eingangs genannten Dokumenten beschrieben, erfolgen. Beispielsweise geht man von üblichen kommerziell
 25 erwerblichen Metallsalzen wie PdCl₂ oder Pd(OCOCH₃)₂ aus und fügt das Phosphin z.B. P(C₆H₅)₃, P(n-C₄H₉)₃, PCH₃(C₆H₅)₂, 1,2-Bis(diphenylphosphino)ethan hinzu.

Die Menge an Phosphin, bezogen auf das Übergangsmetall, beträgt
 30 üblicherweise 0 bis 20, insbesondere 0,1 bis 10 Moläquivalente, besonders bevorzugt 1 bis 5 Moläquivalente.

Die Menge an Übergangsmetall ist nicht kritisch. Natürlich wird man aus Kostengründen eher eine geringe Menge, z.B. von 0,1 bis
 35 10 Mol.-%, insbesondere 1 bis 5 Mol.-%, bezogen auf den Ausgangsstoff IV.

Zur Herstellung der Benzothiazol-5-carbonsäuren IV-1 (R = OH) führt man die Umsetzung mit Kohlenmonoxid und mindestens
 40 äquimolaren Mengen an Wasser, bezogen auf die Ausgangsstoffe XIV durch. Der Reaktionspartner Wasser kann gleichzeitig auch als Lösungsmittel dienen, d.h. die maximale Menge ist nicht kritisch.

147

Es kann aber auch je nach Art der Ausgangsstoffe und der verwendeten Katalysatoren von Vorteil sein, anstelle des Reaktionspartners ein anderes inertes Lösungsmittel oder die für die Carboxylierung verwendete Base als Lösungsmittel zu verwenden.

5

Als inerte Lösungsmittel kommen für Carboxylierungsreaktionen übliche Lösungsmittel wie Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Hexan, Pentan, Cyclohexan, Ether z.B. Methyl-tert.butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Dimethoxyethan, substituierte Amide wie Dimethylformamid, persubstituierte Harnstoffe wie Tetra-C₁-C₄-alkylharnstoffe oder Nitrile wie Benzonitril oder Acetonitril in Betracht.

In einer bevorzugten Ausführungsform des Verfahrens verwendet man einen der Reaktionspartner, insbesondere die Base, im Überschuß, so daß kein zusätzliches Lösungsmittel erforderlich ist.

Für das Verfahren geeignete Basen sind alle inerten Basen, die den bei der Umsetzung freiwerdenden Jodwasserstoff bzw. Bromwasserstoff zu binden vermögen. Beispielsweise sind hier tertiäre Amine wie tert.-Alkylamine, z.B. Trialkylamine wie Triethylamin, cyclische Amine wie N-Methylpiperidin oder N,N'-Dimethylpiperazin, Pyridin, Alkali- oder -hydrogencarbonate, oder tetraalkylsubstituierte Harnstoffderivate wie Tetra-C₁-C₄-alkylharnstoff, z.B. Tetramethylharnstoff, zu nennen.

Die Menge an Base ist nicht kritisch, üblicherweise werden 1 bis 10, insbesondere 1 bis 5 Mol verwendet. Bei gleichzeitiger Verwendung der Base als Lösungsmittel, wird die Menge in der Regel so bemessen, daß die Reaktionspartner gelöst sind, wobei man aus Praktikabilitätsgründen unnötig hohe Überschüsse vermeidet, um Kosten zu sparen, kleine Reaktionsgefäße einsetzen zu können und den Reaktionspartnern maximalen Kontakt zu gewährleisten.

Während der Umsetzung wird der Kohlenmonoxiddruck so eingestellt, daß immer ein Überschuß an CO, bezogen auf XIV vorliegt. Vorzugsweise liegt der Kohlenmonoxiddruck bei Raumtemperatur bei 1 bis 250 bar, insbesondere 5 bis 150 bar CO.

Die Carbonylierung wird in der Regel bei Temperaturen von 20 bis 250°C, insbesondere bei 30 bis 150°C kontinuierlich oder diskontinuierlich durchgeführt. Bei diskontinuierlichem Betrieb wird zweckmäßigerweise zur Aufrechterhaltung eines konstanten Druckes kontinuierlich Kohlenmonoxid auf das Umsetzungsgemisch aufgebracht.

148

Die als Ausgangsverbindungen benutzten 5-Brombenzothiazole XIV sind bekannt oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen sowie nach der in Schema 3 beschriebenen Reaktionsfolge hergestellt werden.

5

Gemäß Schema 3 kann man beispielsweise o-Chlornitrobenzole der allgemeinen Formel XIII mit Alkalisalzen von Alkylmercaptanen in die entsprechenden o-Nitrothioether umwandeln (Schritt k). Der so erhaltene Thioether kann selektiv in der 3-Position zur Nitro-

10 gruppe bromiert werden (Schritt l). Übliche Bromierungsreagenzien sind für diesen Zweck neben Brom - gegebenenfalls in Kombination mit einer Lewis-Säure wie FeBr_3 , auch N-Bromsuccinimid, N-Bromhydantoin und Pyridiniumperbromid. Die Bromierung erfolgt vorzugsweise in einem organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem

15 aliphatischen oder cycloaliphatischen Kohlenwasserstoff, Halogenkohlenwasserstoff oder wasserfreien organischen Säuren bei Temperaturen im Bereich von -15 bis 150°C , vorzugsweise im Bereich von -15 bis 100°C (siehe z.B. Organikum, 16. Aufl., 1986, S. 315). Anschließend wird in Schritt m) die Nitrogruppe zur Aminogruppe re-

20 duziert. Die Bedingungen für Schritt m) entsprechen den für Schritt c) in Schema 1 angegebenen Bedingungen. Anschließend wird der o-Aminothioether aus Schritt m) in Schritt n) zum 5-Brombenzothiazol XIV cyclisiert. Die hierfür erforderlichen Reaktionsbedingungen entsprechen den für Schritt a) in Schema 1 angegebenen

25 Bedingungen.

Zur Herstellung der Benzothiazol-S-dioxid-Verbindungen der allgemeinen Formel I ($\text{Y} = \text{SO}_2$) werden beispielsweise die Benzothiazol-5-carbonsäuren IV-1a oder IV-1b oder die 5-Brombenzothiazol-5-carbonsäuren XIV mit einem Oxidationsmittel umgesetzt, wobei das entsprechende S-Dioxid erhalten wird, das dann weiter wie beschrieben zur Zielverbindung der Formel I mit $\text{Y} = \text{SO}_2$ weiterver-

30 arbeitet wird. Bevorzugt wird jedoch zunächst der Thiomethylether der allgemeinen Formel VIII (Schema 1, Formel VIII mit $\text{R} = \text{H}$ und

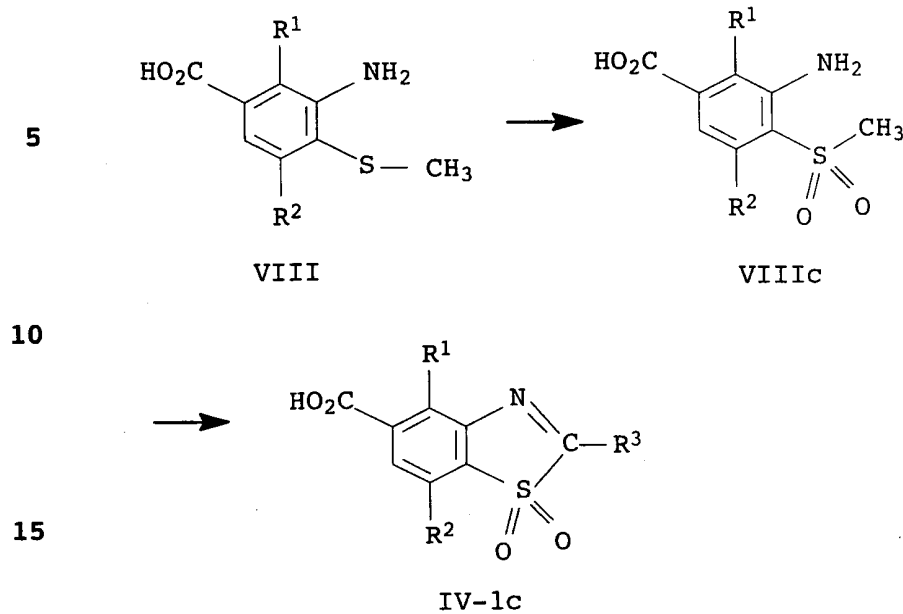
35 $\text{R}' = \text{CH}_3$) zum S-Dioxid VIIIc oxidiert und anschließend zur Benzothiazol-S-dioxid-5-carbonsäure der Formel IV-1c cyclisiert.

40

45

149

Schema 1a



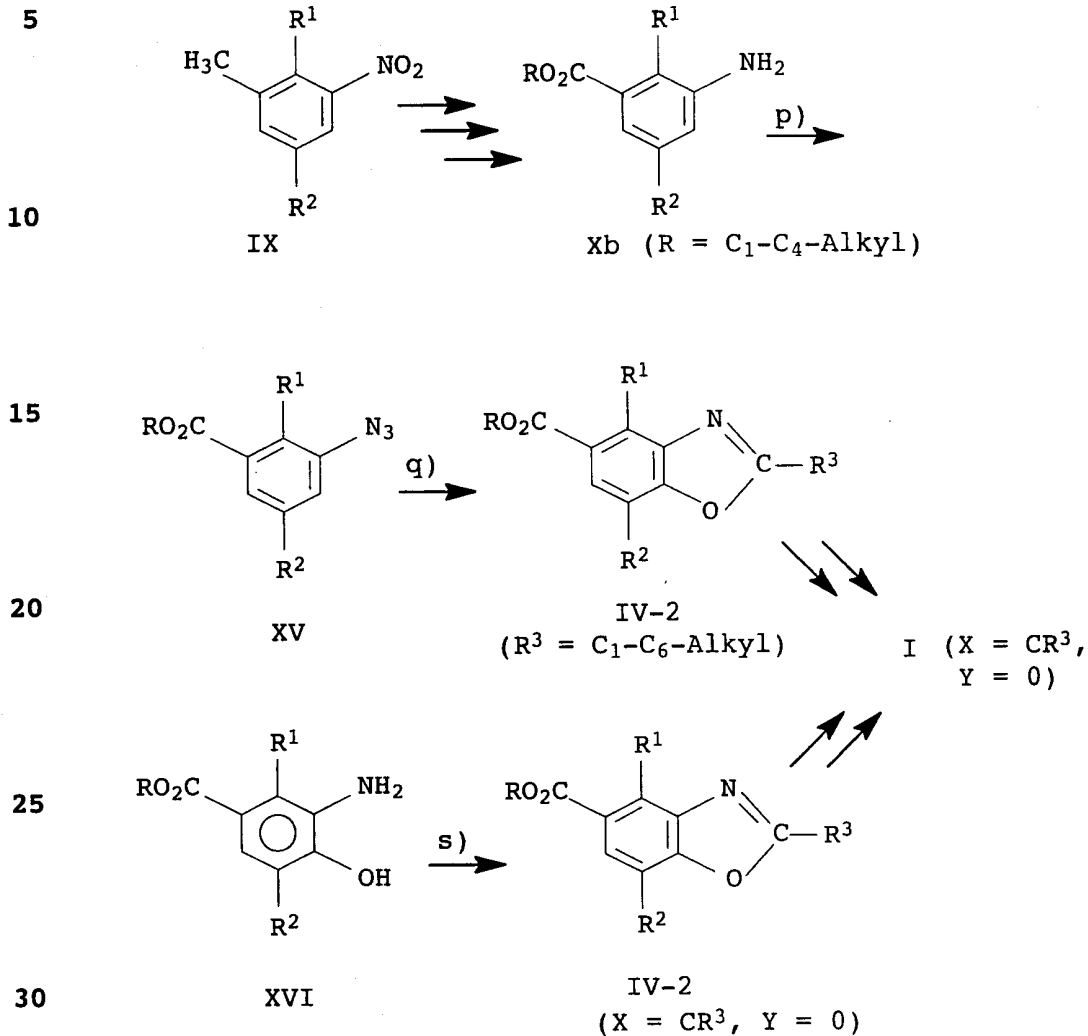
Die Oxidation von VIII zum S-Dioxid gelingt mit Oxidationsmitteln
 20 wie Peroxysäuren, z.B. m-Chlorperbenzoesäure, Peroxyessigsäure,
 Trifluorperoxyessigsäure oder mit Wasserstoffperoxid, das vor-
 zugsweise zusammen mit einem Übergangsmetall-Katalysator, z.B.
 Natriumwolframat(VI), eingesetzt wird. Die Cyclisierung von o-Me-
 thylsulfonylaminobenzolen der Formel VIIIc gelingt in Anlehnung
 25 an die in Chem. Heterocycl. Comp. Bd.3, 1967, S.197 ff beschrie-
 bene Methode.

Eine Synthese für Benzoxazol-5-carbonsäurederivate der allgemei-
 nen Formel IV-2 ($X = C-R^3$, $Y = O$) wird in Schema 4 beschrieben.
 30 Hierbei wird zunächst ausgehend von 3-Nitrotoluolen der allgemei-
 nen Formel IX in der für Schema 1 beschriebenen Weise ein 3-Amin-
 benzooesäureester der allgemeinen Formel Xb ($R = C_1-C_4$ -Alkyl) her-
 gestellt. In Schritt p) wird zunächst die Aminogruppe in Xb in
 bekannter Weise diazotiert und anschließend mit Alkylaziden zu
 35 den entsprechenden 3-Azidobenzooesäuren der allgemeinen Formel XV
 umgesetzt. Das Azid XV wird anschließend in Reaktionsschritt q)
 mit einer Alkylcarbonsäure, die gegebenenfalls auch halogeniert
 sein kann, z.B. Ameisensäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure oder
 Propionsäure zum Benzoxazol-5-carbonsäureester der allgemeinen
 40 Formel IV-2a ($R^3: C_1-C_4$ -Alkyl) umgesetzt. Die Verbindung IV-2a
 kann entweder direkt zum erfindungsgemäßen Cyclohexenonderivat
 der allgemeinen Formel I mit $X = CR^3$ und $Y = O$ umgesetzt werden
 oder alternativ in Reaktionsschritt r) zum o-Aminophenol der all-
 gemeinen Formel XVI hydrolysiert werden. Die Verbindungen XVI
 45 können dann ähnlich wie die o-Aminothiophenole der allgemeinen

150

Formel VIII zu den Benzoxazol-5-carbonsäureestern der allgemeinen Formel IV-2 umgesetzt werden.

Schema 4



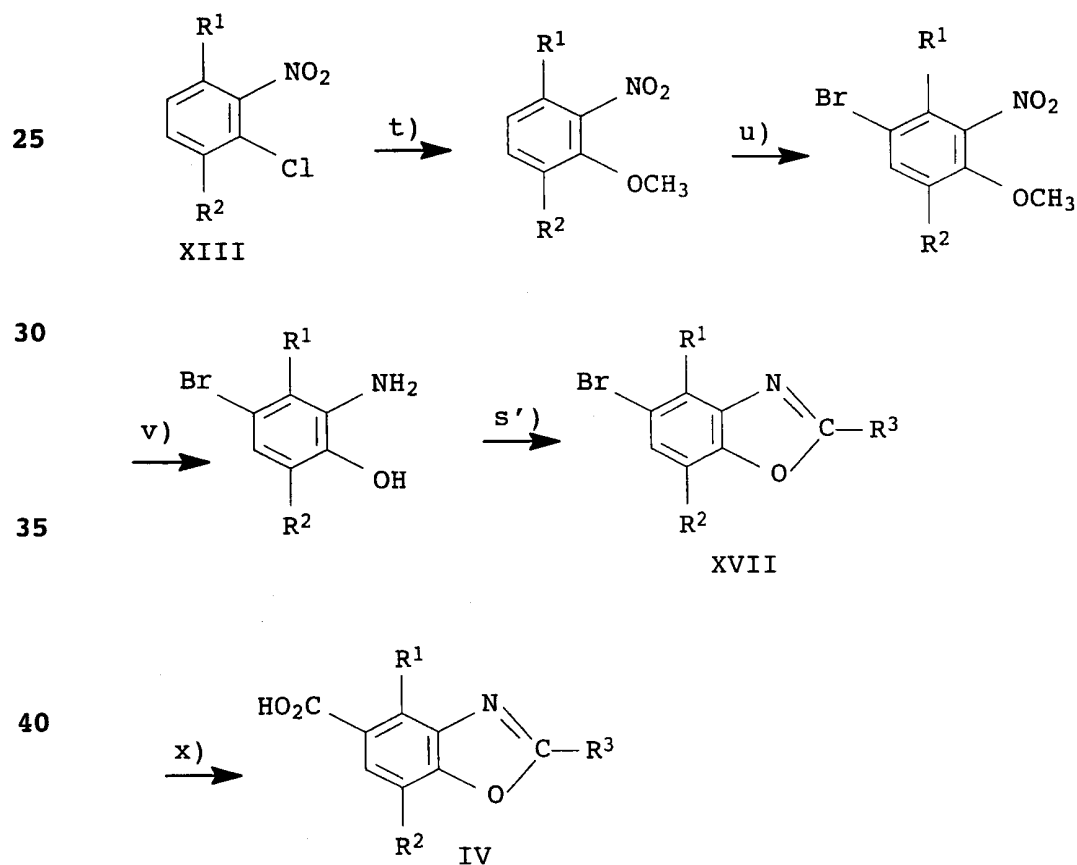
In Reaktionsschritt p) wird zunächst aus dem Amin der allgemeinen Formel Xb in wässriger saurer Lösung oder in einer wasserfreien Säure wie z.B. Ameisensäure, Essigsäure oder Trifluoressigsäure mit einem anorganischen Nitrit wie Natriumnitrit oder einem organischen Nitrit wie Isoamylnitrit eine aromatische Diazoniumverbindung hergestellt. Diese wird durch Zugabe eines Alkaliazids, beispielsweise Natriumazid zu der Lösung oder Suspension der Diazoniumverbindung umgesetzt, wobei man den 3-Azidobenzoessäureester gemäß Schema 4 erhält. Die Reaktionstemperatur der Umsetzung liegt in der Regel im Bereich von -15 bis +50°C, vorzugsweise im Bereich von 0 bis 20°C. Siehe auch K. G. Pinney et al., J. Org. Chem. [JOCEAH] 1991, 56 (9), 3125-3133.

151

Reaktionsschritt q) wird vorzugsweise in der zur Kondensation gewünschten wasserfreien Säure HOOC-R^3 in einem aromatischen Kohlenwasserstoff, wie Benzol, Toluol, Xylol oder Chlorbenzol durchgeführt. Die Reaktionstemperatur liegt in der Regel im Bereich von 50 bis 150°C und vorzugsweise im Bereich von 50 bis 145°C . (Siehe hierzu auch B. Decroix et al., Bull. Soc. Chim. Fr. 1976, 621; S. Chaudhury et al., Can. J. Chem. 1982, 60, 1122). Die Verseifung des in Schritt q) erhaltenen Benzoxazol-5-carbonsäureesters zum 3-Amino-4-hydroxybenzoesäureester der allgemeinen Formel XVI erfolgt beispielsweise unter den für Reaktionsschritt e) in Schema 1 angegebenen Bedingungen. Die Kondensation von Verbindung XVI zum Benzoxazol-5-carbonsäureester in Schritt s) erfolgt beispielsweise unter den für Schritt a) in Schema 1 angegebenen Reaktionsbedingungen. (Siehe zu Schritt s) auch Houben-Weyl "Methoden der organischen Chemie, Bd.E8a, 1993, S.1020 f.)

Ein anderer Zugang zu Benzoxazol-5-carbonsäuren der allgemeinen Formel IV ($\text{X} = \text{C-R}^3$, $\text{Y} = \text{O}$) ist in Schema 5 angegeben.

20 Schema 5



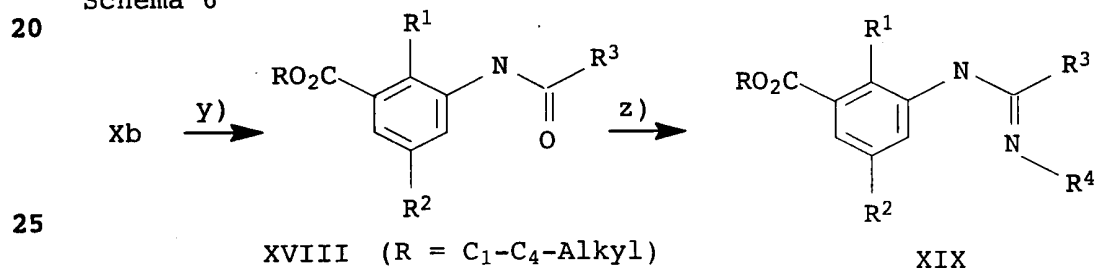
152

Hierbei wird zunächst ein o-Chlornitrobenzol der allgemeinen Formel XIII durch nukleophilen Austausch von Halogen gegen Methoxy in ein o-Nitroanisol überführt (Schritt t)). Dieses wird dann unter den für Schritt l) in Schema 3 angegebenen Reaktionsbedingungen 5 bromiert, wobei das Bromatom selektiv in die p-Position zur Methoxygruppe entritt. Das bromierte Nitroanisol wird dann zunächst selektiv zur Aminoverbindung reduziert und anschließend die Hydroxyfunktion durch Etherspaltung freigesetzt. Hierbei erhält man 2-Amino-4-bromphenole. Diese werden dann unter den für 10 Schritt s) angegebenen Reaktionsbedingungen zum 5-Brombenzoxazol der allgemeinen Formel XVII cyclisiert. Die Verbindung XVII wird dann unter den für Schritt o) in Schema 3 beschriebenen Reaktionsbedingungen zu der Benzoxazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IV ($X = C-R^3$ und $Y = O$) umgesetzt.

15

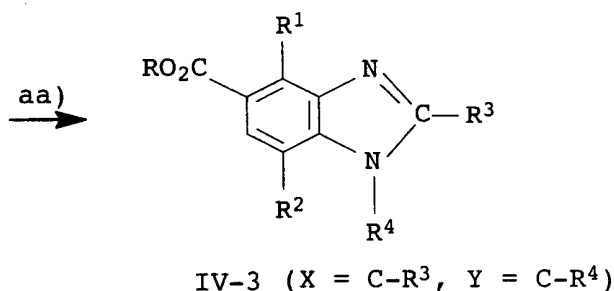
Ein Verfahren zur Herstellung von Benzimidazol-5-carbonsäureestern ist in Schema 6 angegeben.

20 Schema 6



25

30



35

Hierbei geht man zunächst wieder von 3-Nitrotoluolen aus, die in der zuvor beschriebenen Weise in 3-Aminobenzoessäureester der allgemeinen Formel Xb überführt werden. Die Verbindungen Xb werden 40 dann in Reaktionsschritt y) mit einer Carbonsäure der allgemeinen Formel R^3-CO_2H oder einem reaktiven Carbonsäureäquivalent $RCOL^1$, worin L^1 die zuvor genannte Bedeutung hat, zu einem Carbonsäureamid der allgemeinen Formel XVIII umgesetzt. Hierin hat R^3 eine der zuvor angegebenen Bedeutungen. XVIII wird dann unter sauren Bedingungen, z.B. mit Phosgen oder Phosphorylchlorid, in ein Nitriumion überführt, das mit einem Amin der allgemeinen Formel 45 R^4-NH_2 oder mit Ammoniak abgefangen wird, wobei ein Iminoamid der

153

Formel XIX entsteht. Die Verbindung XIX kann dann unter oxidierenden Bedingungen, wie beispielsweise für Reaktionsschritt b) oder g) in Schema 1 beschrieben, zum Benzimidazol-5-carbonsäureester umgesetzt werden, der seinerseits zur Carbonsäure verseift werden kann.

Schritt y) wird in der Regel unter den für die Umsetzung von Carbonsäuren oder Carbonsäurederivaten mit aromatischen Aminen zu Carbonsäureamiden üblichen Reaktionsbedingungen durchgeführt. Die Reaktionstemperatur liegt in der Regel im Bereich von -15 bis 200°C, vorzugsweise im Bereich von 20 bis 150°C.

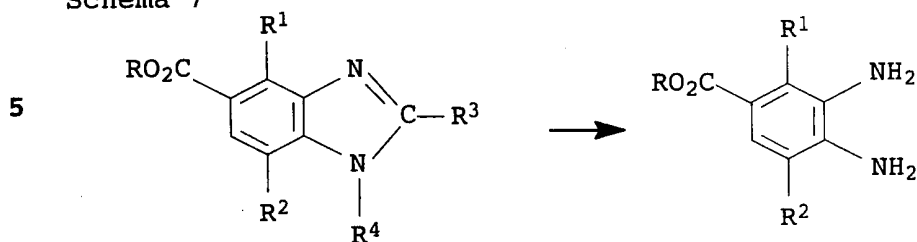
Zur Herstellung des Iminoamids der allgemeinen Formel XIX wird zunächst das Amid der allgemeinen Formel XVIII unter Wasseraus-

schluß in einem organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem der vorgenannten cycloaliphatischen oder aromatischen Kohlenwasserstoffe oder einem Ether gelöst und mit einer anorganischen Säure, beispielsweise Salzsäure oder Schwefelsäure, einer Lewis-Säure wie Titan-tetrachlorid oder einem Säurechlorid wie Sulfonylchlorid, Sulfurylchlorid, Phosphorylchlorid oder Phosgen in das Nitriliumion überführt. Die hierfür erforderlichen Temperaturen liegen in der Regel im Bereich von -15 bis 150°C und vorzugsweise im Bereich von 20 bis 140°C. Das Nitriliumion wird dann mit Ammoniak oder einem Amin der allgemeinen Formel R^4-NH_2 abgefangen.

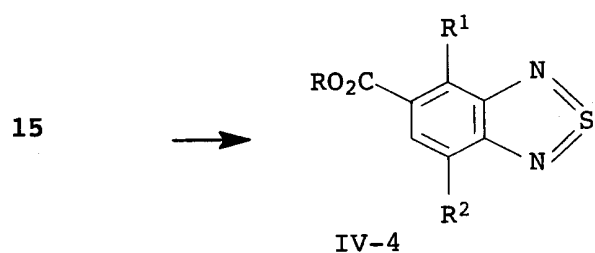
Die Cyclisierung der Verbindung XIX zum Benzimidazol-5-carbonsäureester der allgemeinen Formel IV ($X = C-R^3$, $Y = C-R^4$) wird in der Regel mittels eines Oxidationsmittels wie Bleitetraacetat, Thallium(III)nitrit, Sulfurylchlorid oder Natriumhypochlorid unter wasserfreien Bedingungen durchgeführt. Als Lösungsmittel dienen beispielsweise aliphatische oder cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe oder Ether. Die Umsetzung erfolgt in der Regel bei Temperaturen im Bereich -15 bis +150°C und vorzugsweise im Bereich von 0 bis 140°C. Zur Herstellung von Benzimidazolen aus Iminoamiden siehe auch (Can. J. Chem. 1982, 60, S.1122).

Die Herstellung von Benzoisothiodiazolen der allgemeinen Formel IV-4 ($X-Y = S=N$) gelingt beispielsweise ausgehend von Benzimidazol-5-carbonsäuren oder ihren Estern in der in Schema 7 beschriebenen Weise.

Schema 7



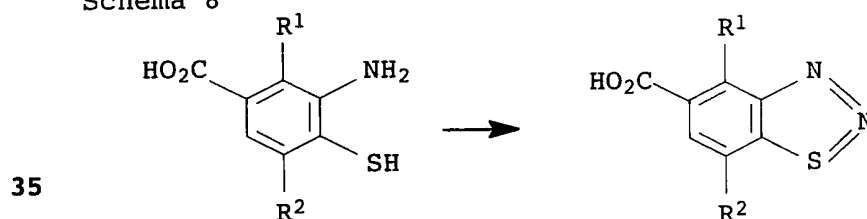
10 IV-3 (X = C-R³, Y = C-R⁴)
R = H oder C₁-C₄-Alkyl



20 Hierbei wird zunächst ein Benzimidazol-carbonsäureester oder die freie Carbonsäure zu 3,4-Diaminobenzoessäure verseift. Diese wird anschließend mit schwefliger Säure oder ihren Derivaten, z.B. SO₂ oder SO₂Cl₂, zur Benzoisothiadiazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IV-4 cyclisiert. Üblicherweise wird die Cyclisierung bei

25 Temperaturen im Bereich von 0 bis 200°C und vorzugsweise im Bereich von 50 bis 150°C, z.B. in einem Lösungsmittel oder in der Schmelze, durchgeführt (siehe auch: Chem. Ber. 1967, Bd.100, S. 2164).

30 Schema 8



VIII (R = R' = H)

IV-5

40 Benzothiadiazol-5-carbonsäuren der allgemeinen Formel IV-5 (X = N, Y = S) können ausgehend von 2-Aminothiophenol-5-carbonsäuren der allgemeinen Formel VIII (R = R' = H) hergestellt werden. Hierzu wird man die Verbindungen der allgemeinen Formel VIII zunächst diazotieren, beispielsweise durch Umsetzung mit organi-

45 schem oder anorganischem Nitrit in einem wässrigen, neutralen Reaktionsmedium bei Temperaturen im Bereich von -15 bis +20°C. Die wässrige Lösung oder Suspension des Diazoniumsalzes wird an-

155

schließlich angesäuert, wobei sich die Verbindung der allgemeinen Formel IV-5 bildet. Diese kann in konventioneller Weise aus der Reaktionmischung, beispielsweise durch Extraktion mit einem organischen Lösungsmittel, gewonnen werden. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen VIII ist in Schema 1 beschrieben. Die Herstellung der Benzothiadiazolcarbonsäuren IV-5 (X = N, Y = S) kann beispielsweise in Anlehnung an das in der US 5,770,758 beschriebene Verfahren erfolgen.

10 Beispiele

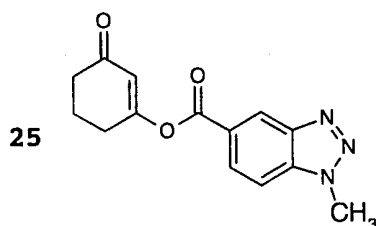
Verwendete Abkürzungen:

EDC = Ethyl-(3'-dimethylaminopropyl)carbodiimid

15 DMAP = 4-Dimethylaminopyridin

5-(1'-Hydroxycyclohex-2'-en-3'-on-2'-ylcarbonyl)-1-methylbenzotriazol (Beispiel 1)

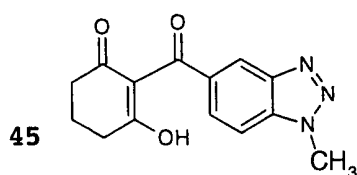
20 1.1 1-Methylbenzotriazol-5-carbonsäure(cyclohexen-3-on-1-yl)ester



30 1,5 g 1-Methylbenzotriazol-5-carbonsäure (8,5 mmol) und 1,0 g 1,3-Cyclohexandion (8,9 mmol) wurden in 30 ml abs. Acetonitril gelöst und mit 1,6 g EDC (8,5 mmol), 2 ml Triethylamin und einer kat. Menge DMAP versetzt. Nach beendeter Reaktion wurde die Lösung auf Wasser gegeben und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen der organischen Phase

35 wurde das Produkt durch Kristallisation gereinigt. Ausbeute: 1.35 g (59%).
Smp.: 154 - 158°C

40 1.2 5-(1'-Hydroxycyclohex-2'-en-3'-on-2'-ylcarbonyl)-1-methylbenzotriazol

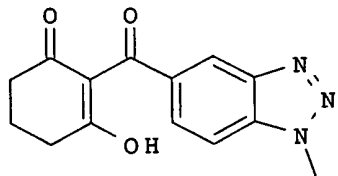
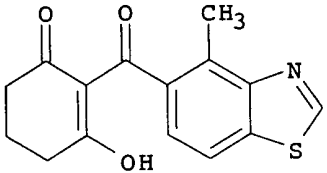
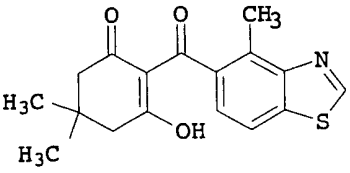


156

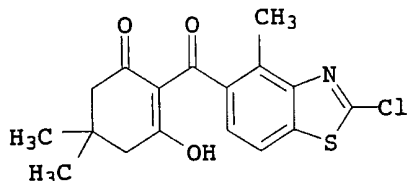
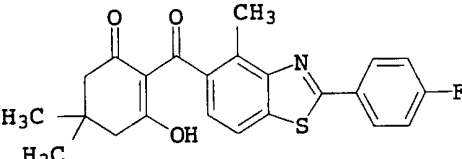
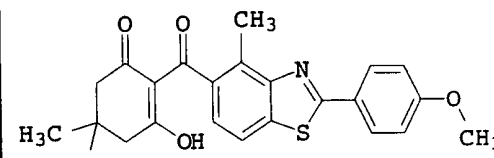
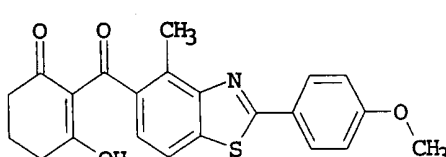
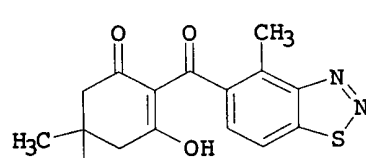
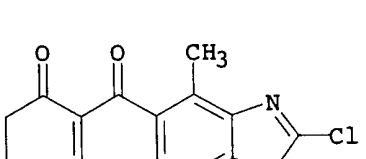
0,74 g (2,7 mmol) 1-Methyl-benzotriazol-5-carbonsäure(cyclohexen-3-on-1-yl)ester wurden in 30 ml Acetonitril gelöst und mit 0,53 g Triethylamin (5,3 mmol) und 0,15 g Trimethylsilylcyanid (1,5 mmol) versetzt. Man rührte bei Raumtemperatur bis zum vollständigen Umsatz, entfernte das Lösungsmittel im Vakuum und nahm den Rückstand mit Wasser auf. Die wässrige Phase wurde mit Methylenchlorid extrahiert, auf pH 2 eingestellt und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Entfernen des Lösungsmittels wurde das Produkt durch Ausrühren gereinigt. Ausbeute: 0,5 g (68%).

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, TMS) δ = 2,03 (m, 2H); 2,48 (m, 4H); 4,37 (s, 3H); 7,90 (d, 1H); 7,98 (d, 1H); 8,22 (s, 1H).

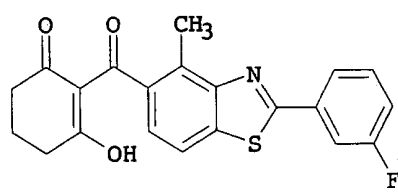
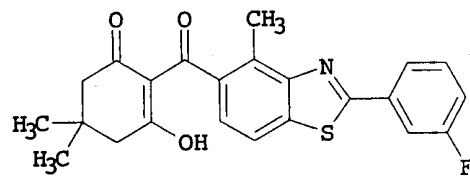
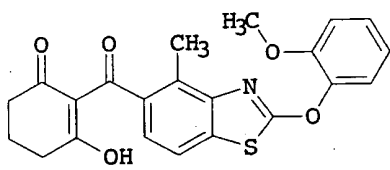
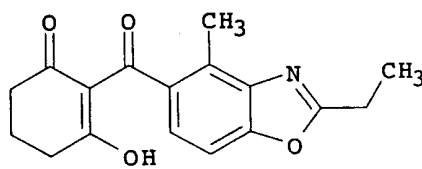
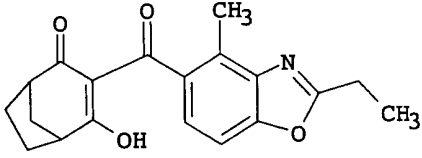
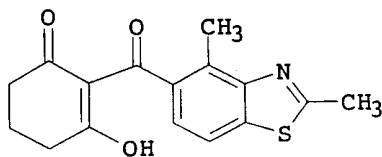
In analoger Weise wurden die Verbindungen I der Beispiele 2 bis 40 durch Umsetzung der jeweiligen Carbonsäure IVa mit dem entsprechenden Cyclohexan-1,3-dion hergestellt.

Bsp.	Struktur / Verbindung-Nr.	Smp. [$^{\circ}\text{C}$] oder $^1\text{H-NMR}$ [ppm]
1	 I-4a.37	$\text{D}_6\text{-DMSO}$, TMS: 2.03 (m, 2H), 2.48 (m, 4H), 4.37 (s, 3H), 7.90 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 8.22 (s, 1H) ppm.
2	 I-1a.394	211-215 $^{\circ}\text{C}$
3	 I-1c.394	127-130 $^{\circ}\text{C}$

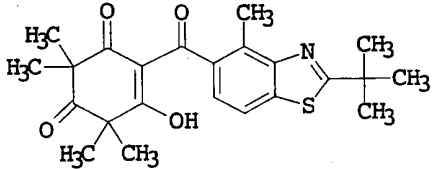
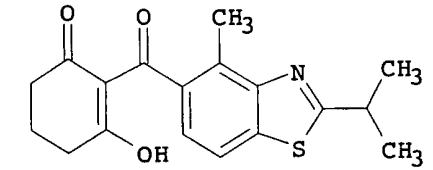
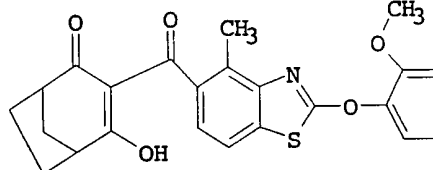
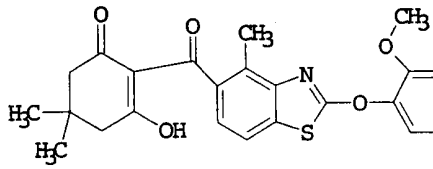
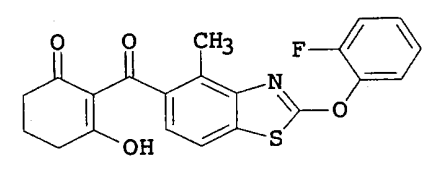
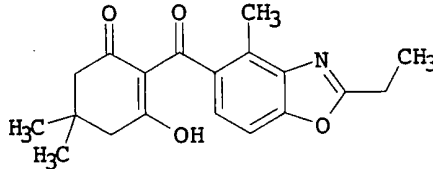
157

5	4	 <p>I-1c.396</p>	<p>CDCl₃, TMS: 1.12 (s, 6H), 2.34 (s, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.65 (s, 2H), 7.18 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 17.64 (OH) ppm.</p>
10	5	 <p>I-1c.457</p>	<p>CDCl₃, TMS: 1.12 (s, 6H), 2.35 (s, 2H), 2.64 (s, 2H), 2.70 (s, 2H), 7.1 – 7.2 (m, 3H), 7.76 (d, 1H), 8.05 – 8.15 (m, 2H), 17.75 (OH) ppm.</p>
15	6	 <p>I-1c.466</p>	<p>CDCl₃, TMS: 1.13 (s, 6H), 2.35 (s, 2H), 2.64 (s, 2H), 2.72 (s, 2H), 3.87 (s, 3H), 6.98 (d, 2H), 7.1 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 8.02 (d, 2H), 17.78 (OH) ppm.</p>
20	7	 <p>I-1a.466</p>	<p>CDCl₃, TMS: 2.04 (m, 2H), 2.45 (t, 2H), 2.74 (s, 3H), 2.79 (t, 2H), 3.84 (s, 3H), 6.98 (d, 2H), 7.1 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 8.02 (d, 2H), 17.68 (OH) ppm.</p>
25	8	 <p>I-4c.2</p>	<p>120–122°C</p>
30	9	 <p>I-1a.396</p>	<p>154–155°C</p>

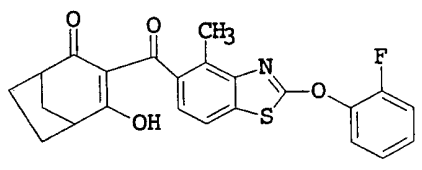
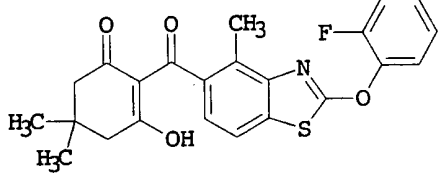
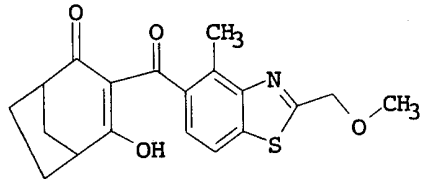
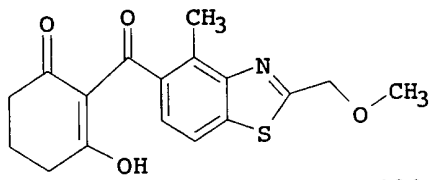
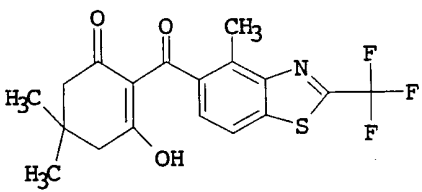
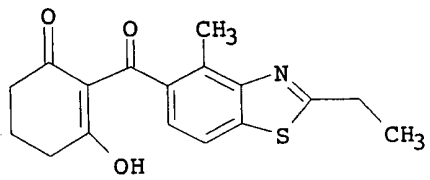
158

5	10	 <p>I-1a.456</p>	148-150°C
10	11	 <p>I-1c.456</p>	158-160°C
15	12	 <p>I-1a.802</p>	150-155°C
20	13	 <p>I-2a.406</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.42 (t, 3H), 2.04 (m, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.63 (4H), 2.98 (q, 2H), 7.07 (d, 1H), 7.33 (d, 1H), 17.64 (OH) ppm.
25	14	 <p>I-2x.406</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.42 (t, 3H), 1.7-1.85 (m, 2H), 2.0-2.34 (m, 4H), 2.48 (s, 3H), 2.9 (1H), 2.98 (q, 2H), 3.18 (1H), 7.08 (d, 1H), 7.33 (d, 1H), 17.68 (OH) ppm.
30	15	 <p>I-1a.405</p>	112-115°C

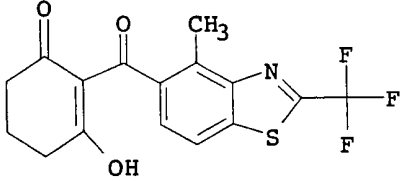
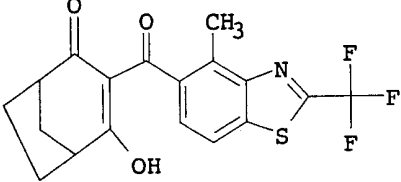
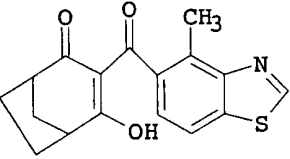
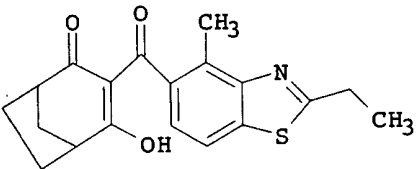
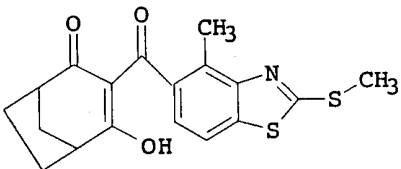
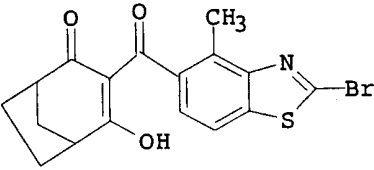
159

5	16	 <p style="text-align: center;">I-1d.412</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.34 (s, 6H), 1.49 (s, 9H), 1.56 (s, 6H), 2.70 (s, 3H), 7.04 (d, 1H), 7.7 (d, 1H), 17.95 (OH) ppm.
10	17	 <p style="text-align: center;">I-1a.408</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.42 (d, 6H), 2.08 (m, 2H), 2.46 (2H), 2.64 (s, 3H), 2.8 (2H), 3.42 (m, 1H), 7.09 (d, 1H), 7.7 (d, 1H), 17.7 (OH) ppm.
15	18	 <p style="text-align: center;">I-1x.802</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.7 – 1.85 (m, 2H), 2.0 – 2.34 (m, 4H), 2.48 (s, 3H), 2.9 (1H), 3.18 (1H), 3.92 (s, 3H), 7.0 – 7.1 (m, 3H), 7.25 – 7.38 (m, 2H), 7.67 (d, 1H), 17.65 (OH) ppm.
20	19	 <p style="text-align: center;">I-1c.802</p>	138–141°C
25	20	 <p style="text-align: center;">I-1a.790</p>	CDCl ₃ , TMS: 2.04 (m, 2H), 2.42 (2H), 2.46 (s, 3H), 2.77 (2H), 7.02 (d, 1H), 7.15 – 7.33 (m, 3H), 7.4 – 7.55 (m, 2H), 17.63 (OH) ppm.
30	21	 <p style="text-align: center;">I-2c.406</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.14 (s, 6H), 1.42 (t, 3H), 2.36 (s, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.69 (s, 2H), 2.98 (q, 2H), 7.08 (d, 1H), 7.3 (d, 1H), 17.7 (OH) ppm.

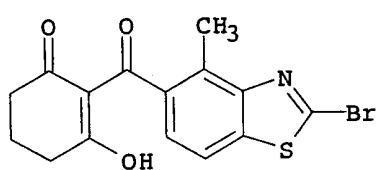
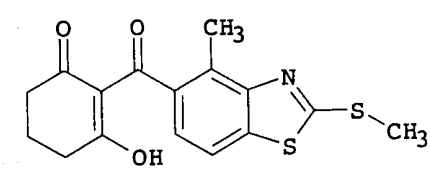
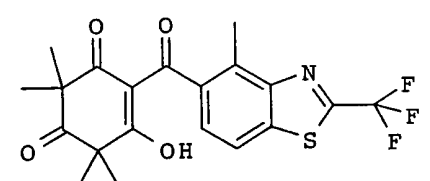
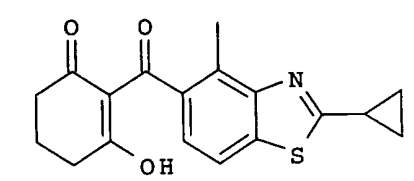
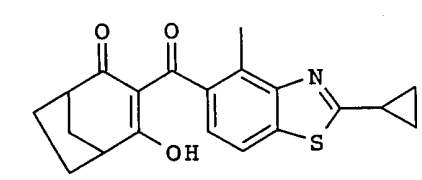
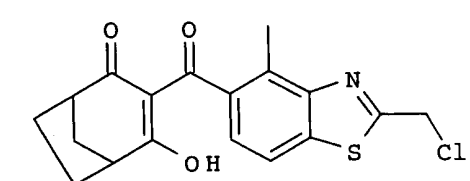
160

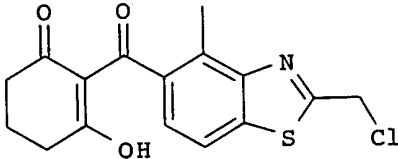
<p>5</p> <p>22</p>	 <p>I-1x.790</p>	<p>CDCl₃, TMS: 1.7 – 1.85 (m, 2H), 2.0 – 2.34 (m, 4H), 2.63 (s, 3H), 2.9 (1H), 3.18 (1H), 7.08 (d, 1H), 7.15 – 7.33 (m, 3H), 7.6 (dd, 1H), 7.7 (d, 1H), 17.6 (OH) ppm.</p>
<p>10</p> <p>23</p> <p>15</p>	 <p>I-1c.790</p>	<p>122–174°C</p>
<p>20</p> <p>24</p>	 <p>I-1x.420</p>	<p>92–98°C</p>
<p>25</p> <p>25</p>	 <p>I-1a.420</p>	<p>97–101°C</p>
<p>30</p> <p>26</p> <p>35</p>	 <p>I-1c.418</p>	<p>160–167°C</p>
<p>40</p> <p>27</p> <p>45</p>	 <p>I-1a.406</p>	<p>99–101°C</p>

161

5	28	 <p>I-1a.418</p>	167-170°C
10	29	 <p>I-1x.418</p>	127-143°C
15	30	 <p>I-1x.394</p>	128-136°C
20	31	 <p>I-1x.406</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.42 (t, 3H), 1.7 – 1.9 (m, 2H), 2.0 – 2.3 (m, 4H), 2.62 (s, 3H), 2.9 (1H), 3.18 (m, 3H), 7.1 (d, 1H), 7.7 (d, 1H), 17.7 (OH) ppm.
25	32	 <p>I-1x.435</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.7 – 1.8 (m, 2H), 2.0 – 2.3 (m, 4H), 2.6 (s, 3H), 2.78 (s, 3H), 2.9 (1H), 3.18 (1H), 7.04 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 17.7 (OH) ppm.
30	33	 <p>I-1x.397</p>	70-73°C
35			
40			
45			

162

5	34	 <p>I-1a.397</p>	149-152°C
10	35	 <p>I-1a.435</p>	CDCl ₃ , TMS: 2.0 (m, 2H), 2.52 (2H), 2.59 (s, 3H), 2.78 (s, 3H), 2.9 (2H), 7.03 (d, 1H), 7.6 (d, 1H), 17.7 (OH) ppm.
15	36	 <p>I-1d.418</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.3 (s, 6H), 1.38 (s, 6H), 2.78 (s, 3H), 7.27 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 17.7 (OH) ppm.
20	37	 <p>I-1a.808</p>	129-133°C
25	38	 <p>I-1x.808</p>	125-128°C
30	39	 <p>I-1x.413</p>	CDCl ₃ , TMS: 1.7 - 1.85 (m, 2H), 2.0 - 2.34 (m, 4H), 2.62 (s, 3H), 2.9 (1H), 3.18 (1H), 4.93 (s, 2H), 7.17 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 17.7 (OH) ppm.
35			
40			
45			

5 40	 <p style="text-align: center;">I-1a.413</p>	95-97°C
---------	-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	---------

10

Die Verbindungen der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die herbiziden Mittel, die Verbindungen der Formel I enthalten, bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

20

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen der Formel I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen

25 beispielsweise folgende Kulturen:

- Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

- 5 Die Verbindungen der Formel I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, 10 Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

15

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und die in der Regel für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln üblichen Hilfsmittel.

20

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht:

- Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen 25 oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole oder deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare 30 Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

- Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die 35 Thiochromanoylpyrazolon-Derivate der Formel I als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, 40 Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

- Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, 45 Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether-

165

und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der

5 Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenoether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder

10 Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder ge-

15 meinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe her-

20 gestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat,

25 Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Verbindungen der Formel I in den

30 anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa von 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer

35 Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstellung solcher Zubereitungen:

- 40 I. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-mo-
- 45 noethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in

166

100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- 5 II. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 10 10 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 15 III. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 20 20 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 25 IV. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermisch 30 30 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 35 V. 3 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 40 VI. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykoether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
- 45 VII. 1 Gewichtsteil der jeweiligen Verbindung der Formel I wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclo-

167

hexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

- 5 VIII. 1 Gewichtsteil der jeweiligen Verbindung der Formel I wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol^R EM 31 (= nicht-ionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- 10

Die Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

15

20

Die Aufwandmengen an Verbindung der Formel I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0 vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

25

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryl-oxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-Aroyl-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF₃-Phenyl-derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexenonoximetherderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenyl-ether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenyllessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbon-

30

35

40

45

168

säure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.

- 5 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner
- 10 die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Anwendungsbeispiele

15

Die herbizide Wirkung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

- Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit
- 20 etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

- Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um
- 25 Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt
- 30 wurde.

- Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten
- 35 Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 0,25 bzw. 0,125 kg/ha a.S.
- 40 (aktive Substanz).

- Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen
- 45 gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

169

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

5

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

	Bayercode	Deutscher Name	Englischer Name
10	AMARE	Zurückgekrümmter Fuchsschwanz	redroot pigweed
	AVEFA	Flughafer	wild oats
15	CHEAL	Weißer Gänsefuß	lambquarters (goose-foot)
	CAPBP	Hirtentäschelkraut	shepherd's purse
	DIGSA	Blutfingerhirse	Fingergrass ,hairy
	ECHCG	Hühnerhirse	barnyardgrass
20	EPHHL	Wolfsmilchart	spurge
	GASPA	Knopfkraut	smallflower
	GALAP	Klettenlabkraut	catchweed bedstraw
25	LAMAM	Taubnessel, stengelumfassende	henbit
	MYOAR	Vergißmeinnicht	forget-me-not
	PAPRH	Klatschmohn	corn poppy
	POLPE	Flohknöterich	ladysthumb
30	SETIT	Borstenhirse	foxtail
	STEME	Vogelsternmiere	Common chickweed
	SOLNI	Schwarzer Nachtschatten	blach nightshade
35	THLAR	Hellerkraut	fanweed
	TRZAS	Sommer Weizen	spring wheat
	PHBPU	Purpurtrichterwinde	tall morningglory
40	ABUTH	lindenblättrige Schönmalve	velvet leaf
	SETFA	Grosse Borstenhirse	giant foxtail

Die folgenden Untersuchungen wurden im Nachlaufverfahren durchgeführt.

45

170

Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,5 kg/ha (a.S.) zeigte die Verbindung I-1a.394 aus Beispiel 2 im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AMARE, CHEAL, IPOSS und POLPE bei Selektivität in Sommerweizen.

5

Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,5 kg/ha (a.S.) zeigte die Verbindung I-1c.396 aus Beispiel 4 im Nachauflauf eine gute bis sehr gute herbizide Wirkung gegen AMARE, CHEAL, ECHCG und SETFA.

10 Bei Aufwandmengen von 0,125 bzw. 0,25 kg/ha (a.S.) zeigte die Verbindung I-2a.406 aus Beispiel 13 im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen ABUTH, AMARE, CHEAL und IPOSS und eine gute Wirkung gegen GALAP.

15 Bei Aufwandmengen von 0,0625 bzw. 0,125 kg/ha (a.S.) zeigte die Verbindung I-2x.406 aus Beispiel 14 im Nachauflauf eine gute bzw. sehr gute herbizide Wirkung gegen ABUTH, CHEAL, ECHCG und POLPE.

Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha (a.S.) zeigte die
20 Verbindung I-1a.405 aus Beispiel 15 im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AMARE, CHEAL, ECHCG und POLPE.

Bei Aufwandmengen von 0,125 bzw. 0,25 kg/ha (a.S.) zeigte die
25 Verbindung I-1a.408 aus Beispiel 17 im Nachauflauf eine gute bis sehr gute herbizide Wirkung gegen ABUTH, CHEAL, ECHCG und POLPE.

Bei Aufwandmengen von 0,125 bzw. 0,25 kg/ha (a.S.) zeigte die
Verbindung I-1x.790 aus Beispiel 22 im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen CHEAL, ECHCG, POLPE und SETFA.

30

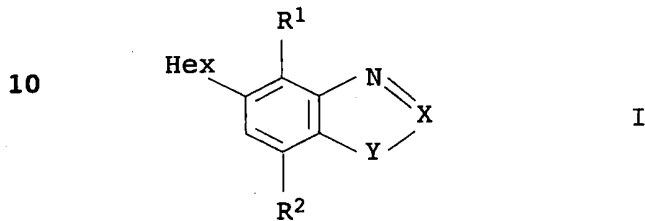
Bei Aufwandmengen von 0,125 bzw. 0,25 kg/ha (a.S.) zeigte die Verbindung I-1x.420 aus Beispiel 24 im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen CHEAL, ECHCG, PHPBU SETFA und POLPE.

35 Bei Aufwandmengen von 0,125 bzw. 0,25 kg/ha (a.S.) zeigte die Verbindung I-1x.406 aus Beispiel 31 im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen ABUTH, CHEAL, ECHCG und POLPE.

Bei Aufwandmengen von 0,0625 bzw. 0,125 kg/ha (a.S.) zeigte die
40 Verbindung I-1x.435 aus Beispiel 32 im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AMARE, CHEAL und ECHCG.

Patentansprüche

- 5 1. Cyclohexenon-Derivate benzokondensierter, ungesättigter
5-Ring-Stickstoffheterocyclen der allgemeinen Formel I,



15

worin

X für N oder eine Gruppe C-R³ steht;

20

Y für O, S, SO, SO₂ oder NR⁴ steht

oder

25

X-Y für S=N stehen, und X Schwefel bedeutet;

R¹ Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl,
C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy,
C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio,
30 C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl,
C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl,
Aminosulfonyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,
C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl,
C₁-C₆-Alkylsulfinyl-C₁-C₆-alkyl,
35 C₁-C₆-Alkylsulfonyl-C₁-C₆-alkyl,
C₁-C₆-Alkylamino-C₁-C₆-alkyl, oder
Di-(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₆-alkyl;

40

R² Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;

R³ Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Amino,
Mercapto, Rhodano, Hydrazid, C₁-C₆-Alkyl,
C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Aminoalkyl,
C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
45 C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Hydroxyalkoxy,
C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl,

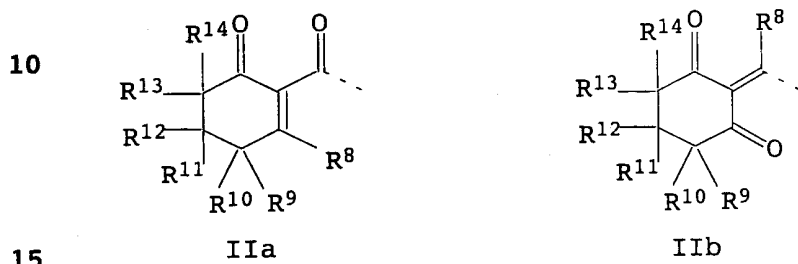
172

- 5 C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino,
C₃-C₆-Cycloalkylamino, wobei die Alkyl- und
Cycloalkylgruppen der drei letztgenannten Reste teilweise
oder vollständig halogeniert und/oder ein bis drei
Substituenten, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkoxy oder Hydroxy
tragen können,
- 10 C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio,
C₁-C₆-Hydroxyalkylthio, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkylthio,
- 15 Phenyl, Naphthyl, Heterocyclyl, Phenoxy, Phenylamino,
Diphenylamino, wobei die Phenyl- und Heterocyclylgruppen
der sechs letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder
vollständig halogeniert und/oder einen, zwei oder drei
Substituenten, ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy,
C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy und
C₁-C₄-Halogenalkoxy, tragen können,
- 20 C(O)OR⁵, oder C(O)N(R⁶)R⁷; und
- R⁴ 25 Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,
Phenyl, Naphthyl, wobei die zwei letztgenannten Reste
ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert und/oder
einen, zwei oder drei Substituenten, ausgewählt unter
Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Halogenalkoxy, tragen können;
bedeuten, wobei
- 30 R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,
Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht, wobei die drei
35 letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig
halogeniert und/oder einen, zwei oder drei Substituenten,
ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl,
C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Halogenalkoxy,
tragen können;
- 40 R⁶, R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl,
C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl,
C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl,
- 45 Phenyl oder Naphthyl stehen, wobei die zwei
letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig
halogeniert und/oder einen, zwei oder drei Substituenten,

173

ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₄-Halogenalkoxy, tragen können; und

- 5 Hex für substituiertes (3-Oxo-1-cyclohexen-2-yl)carbonyl der Formel IIa oder für substituiertes (1,3-Dioxo-2-cyclohexyl)methyliden der Formel IIb steht,



steht, wobei die Variablen R⁸ bis R¹⁴ folgende Bedeutung haben:

- 20 R⁸ Hydroxy, Mercapto, Halogen, OR¹⁵, SR¹⁵, SOR¹⁶, SO₂R¹⁶, OSO₂R¹⁶, P(O)R¹⁷R¹⁸, OP(O)R¹⁷R¹⁸, P(S)R¹⁷R¹⁸, OP(S)R¹⁷R¹⁸, NR¹⁹R²⁰, ONR¹⁹R²⁰ oder N-gebundenes Heterocyclyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen bis
- 25 drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- 30 R⁹, R¹³ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;
- R¹⁰, R¹², R¹⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- 35 R¹¹ Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Di-(C₁-C₆-alkoxy)-methyl, (C₁-C₆-Alkoxy)-(C₁-C₆-alkylthio)-methyl, Di-(C₁-C₆-alkylthio)methyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio,
- 40 C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-carbonyl;
- 45 1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl oder 1,3-Dithian-2-yl, wobei

174

die sechs letztgenannten Reste durch einen bis drei C₁-C₄-Alkylreste substituiert sein können;

oder

5

R¹⁰ und R¹² oder R¹² und R¹⁴ bilden gemeinsam eine π -Bindung oder eine C₁-C₅-Alkylkette, die einen zwei oder drei Reste aus folgender Gruppe tragen kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;

10

oder

R¹⁰ und R¹⁴ bilden gemeinsam eine C₁-C₄-Alkylkette, die einen zwei oder drei Reste aus folgender Gruppe tragen kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;

15

oder

R¹¹ und R¹² bilden gemeinsam eine -O-(CH₂)_p-O-, -O-(CH₂)_p-S-, -S-(CH₂)_p-S-, -O-(CH₂)_q- oder -S-(CH₂)_q-Kette, worin p für 2, 3, 4 oder 5 und q für 2, 3, 4, 5 oder 6 stehen, und die durch einen zwei oder drei Reste aus folgender Gruppe substituiert sein kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;

20

25

oder

R¹¹ und R¹² bilden gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an dem sie gebunden sind, eine Carbonylgruppe;

30

wobei

R¹⁵ C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkinylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkinyloxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthiocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkinylaminocarbonyl, N,N-Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl,

35

40

45

175

- Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl,
 C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, wobei die genannten
 Alkyl-, Cycloalkyl- oder Alkoxyreste partiell oder
 vollständig halogeniert sein können und/oder eine,
 5 zwei oder drei der folgenden Gruppen tragen können:
 Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio,
 Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl,
 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl,
 C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxycarbonyl, Hydroxycarbonyl,
 10 C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl,
 Di-(C₁-C₄-Alkyl)aminocarbonyl, Aminocarbonyl,
 C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy oder C₃-C₆-Cycloalkyl;
- Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl,
 15 Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl,
 Phenoxycarbonyl, Phenoxythiocarbonyl,
 Phenylaminocarbonyl,
 N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-phenylaminocarbonyl,
 Phenyl-C₂-C₆-alkenylcarbonyl, Heterocyclyl,
 20 Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl,
 Heterocyclylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 Heterocyclylcarbonyl, Heterocycliloxycarbonyl,
 Heterocycliloxythiocarbonyl,
 Heterocyclylaminocarbonyl,
 25 N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-heterocyclylaminocarbonyl oder
 Heterocyclyl-C₁-C₆-alkenylcarbonyl, wobei der Phenyl-
 oder der Heterocyclyl-Rest der 18 letztgenannten
 Substituenten partiell oder vollständig halogeniert
 sein kann und/oder einen bis drei der folgenden Reste
 30 tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl,
 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder
 C₁-C₄-Halogenalkoxy; bedeutet;
- R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl oder
 35 C₃-C₆-Cycloalkyl, wobei die vier genannten Reste partiell
 oder vollständig halogeniert sein können und/
 oder eine, zwei oder drei der folgenden Gruppen tra-
 gen können: Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
 C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio,
 40 C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl oder
 C₁-C₄-Halogenalkoxycarbonyl,
- Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Heterocyclyl oder Hetero-
 45 cyclyl-C₁-C₄-alkyl, wobei der Phenyl- oder der Hete-
 rocyclylrest der vier letztgenannten Substituenten
 partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/
 oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen

176

kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl; bedeutet;

- 5 R¹⁷, R¹⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenoxy, wobei die drei
 10 letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl; bedeuten;
- 15 R¹⁹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, Amino,
 20 C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)amino oder C₁-C₆-Alkylcarbonylamino, wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- oder Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen können:
 25 Cyano, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl,
 30 Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylcarbonyl, Heterocyclyl, Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl oder Heterocyclylcarbonyl, wobei der Phenyl- oder Heterocyclyl-Rest der sechs letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert
 35 sein kann und/oder einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; bedeutet;
- 40 R²⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl bedeutet;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

2. Cyclohexenonderivate gemäß Anspruch 1, worin X in Formel I
 45 für C-R³ steht, wobei

177

- R³ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio,
- 5 Phenyl oder Pyridyl, wobei die zwei letztgenannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen der folgenden Reste: C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, und C₁-C₄-Halogenalkoxy, tragen können;
- 10 oder
- COOR⁵ mit den für R⁵ in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen steht.
- 15
3. Cyclohexenonderivate gemäß Anspruch 1 oder 2, worin X in Formel I für C-R³ steht und Y ausgewählt ist unter S, SO und SO₂.
4. Cyclohexenonderivate gemäß einem der Ansprüche 1 oder 2, worin Y in Formel I für N-R⁴ mit der für R⁴ in Anspruch 1 angegebenen Bedeutung steht und X für C-R³ mit den in Anspruch 1 oder 2 für R³ angegebenen Bedeutungen steht.
- 20
5. Cyclohexenonderivate gemäß Anspruch 1, worin X für N steht und Y ausgewählt ist unter S, SO, SO₂ oder N-R⁴.
- 25
6. Cyclohexenonderivate gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, worin Hex in Formel I für einen Rest der Formel IIa steht, worin R⁸ ausgewählt ist unter Hydroxy, Mercapto, Halogen, OR¹⁵, SR¹⁵, SO₂R¹⁶, NR¹⁹R²⁰ und ONR¹⁹R²⁰ mit den für R¹⁵, R¹⁶ und R²⁰ in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen.
- 30
7. Cyclohexenonderivate gemäß Anspruch 6, wobei in Formel IIa
- 35 R⁸ ausgewählt ist unter Hydroxy, C₁-C₄-Alkyloxy, C₁-C₄-Alkylamino, Di-C₁-C₄-Alkylamino, N-(C₁-C₄-Alkyloxy)-N-(C₁-C₄-Alkyl)amino, O-CH₂-Phenyl, Phenylthio, Phenylcarbonyloxy, 2-, 3- oder 4-Fluorphenylcarbonyloxy, C₁-C₄-Methylthio,
- 40 C₁-C₄-Sulfonyloxy, Phenylsulfonyloxy und 2-, 3- oder 4-Methylphenylsulfonyloxy.
8. Cyclohexenonderivate gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche, worin in Formel IIa oder IIb

178

R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³ und R¹⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl stehen,

5 R¹¹ auch für Hydroxy, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halogenalkoxy oder Halogenalkylthio stehen kann,

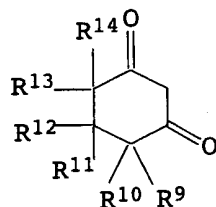
10 R¹¹ und R¹² zusammen mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind auch eine Carbonylgruppe, einen 1,3-Dioxolan-, 1,3-Dithiolan-, 1,3-Oxothiolan-, 1,3-Oxothian-, 1,3-Dithiolan- oder einen 1,3-Dithian-Ring bedeuten können, wobei die 2-Position der sechs genannten Ringe mit dem C-Atom identisch ist, an das R¹¹ und R¹² gebunden sind,

15 R⁹ und R¹³ oder R¹⁰ und R¹⁴ auch eine C₁-C₄-Alkylenkette bedeuten können, oder

20 R¹⁰ und R¹² oder R¹² und R¹³ gemeinsam eine π -Bindung ausbilden können.

9. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I mit R⁸ = Hydroxy, gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein 1,3-Cyclohexandion der Formel III,

25

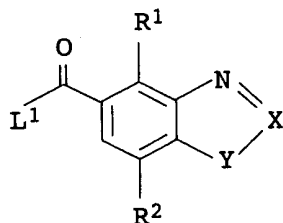


III

30

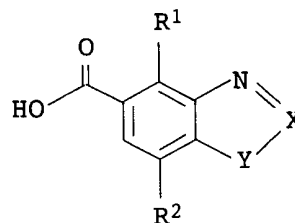
worin die Variablen R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³ und R¹⁴ die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, mit einer aktivierten Carbonsäure IVa oder einer Carbonsäure IVb

35



IVa

40



IVb

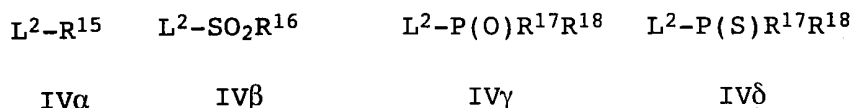
45

worin die Variablen X, Y, R¹ und R² die unter Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L¹ für eine nukleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, acyliert und das Acylierungsprodukt

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators zu den Verbindungen I mit $R^8 = \text{Hydroxy}$ umlagert.

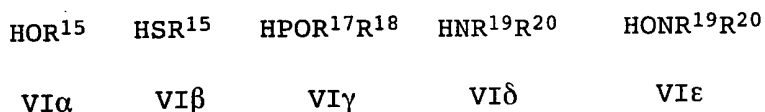
10. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 mit $R^8 = \text{Halogen}$, dadurch gekennzeichnet, dass man ein Cyclohexanon-Derivat der Formel I, mit $R^8 = \text{Hydroxy}$ mit einem Halogenierungsmittel umsetzt.

11. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 mit $R^8 = \text{OR}^{15}$, $\text{OSO}_2\text{R}^{16}$, $\text{OP}(\text{O})\text{R}^{17}\text{R}^{18}$ oder $\text{OP}(\text{S})\text{R}^{17}\text{R}^{18}$ dadurch gekennzeichnet, dass man ein Cyclohexanon-Derivat der Formel I mit $R^8 = \text{Hydroxy}$ mit einem Alkylierungsmittel $\text{V}\alpha$, Sulfonylierungsmittel $\text{V}\beta$ oder Phosphonylierungsmittel $\text{V}\gamma$ beziehungsweise $\text{V}\delta$,



wobei die Variablen R^{15} bis R^{18} die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L^2 für eine nukleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, umgesetzt.

12. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 mit $R^8 = \text{OR}^{15}$, SR^{15} , $\text{P}(\text{O})\text{R}^{17}\text{R}^{18}$, $\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$, $\text{ONR}^{19}\text{R}^{20}$ oder N-gebundenes Heterocyclyl, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Cyclohexanon-Derivat der Formel I mit $R^8 = \text{Halogen}$ oder $\text{OSO}_2\text{R}^{16}$ mit einer Verbindung der Formel $\text{VI}\alpha$, $\text{VI}\beta$, $\text{VI}\gamma$, $\text{VI}\delta$, $\text{VI}\epsilon$ oder $\text{VI}\eta$



H(N-gebundenes
Heterocyclyl)

$\text{VI}\eta$

wobei die Variablen R^8 , R^{11} bis R^{16} die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base, umgesetzt.

180

13. Mittel, enthaltend mindestens ein Cyclohexenon-Derivat der Formel I oder ein landwirtschaftlich brauchbares Salz von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8, und übliche Hilfsmittel.
- 5 14. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Cyclohexenon-Derivates der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8, auf Pflanzen, deren Lebensraum und/
- 10 oder auf Samen einwirken läßt.
15. Verwendung von Cyclohexenon-Derivaten der Formel I oder deren landwirtschaftlich brauchbaren Salzen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 als Herbizide.

15

20

25

30

35

40

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 00/04042

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D249/18 C07D271/12 C07D285/14 C07D263/54 C07D277/62
 C07D235/04 A01N43/647 A01N43 /78 A01N43/828 A01N43/76

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

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

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

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	EP 0 283 261 A (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC ET AL) 21 September 1988 (1988-09-21) cited in the application the whole document, in particular claim 5	1-15
X	WO 97 09324 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 13 March 1997 (1997-03-13) cited in the application the whole document	1-15

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

29 August 2000

Date of mailing of the international search report

07/09/2000

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

Allard, M

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 00/04042

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 283261 A	21-09-1988	AT 110067 T	15-09-1994
		AU 603648 B	22-11-1990
		AU 1311388 A	22-09-1988
		AU 602962 B	01-11-1990
		AU 1328088 A	24-11-1988
		BR 8801209 A	25-10-1988
		CA 1340284 A	22-12-1998
		DE 3851073 D	22-09-1994
		DE 3851073 T	02-03-1995
		EP 0283152 A	21-09-1988
		ES 2058257 T	01-11-1994
		HU 46881 A, B	28-12-1988
		JP 63264542 A	01-11-1988
		JP 1006256 A	10-01-1989
		JP 2579663 B	05-02-1997
		US 5958839 A	28-09-1999
		US 5426091 A	20-06-1995
		US 4912262 A	27-03-1990
		US 5563115 A	08-10-1996
		US 5041681 A	20-08-1991
		US 5098464 A	24-03-1992
		US 5744610 A	28-04-1998
		US 5210312 A	11-05-1993
		US 5250501 A	05-10-1993
		YU 53988 A	28-02-1990
		YU 165289 A	31-12-1990
		ZA 8801483 A	30-11-1988
WO 9709324 A	13-03-1997	DE 19532311 A	06-03-1997
		AU 717015 B	16-03-2000
		AU 6929796 A	27-03-1997
		BG 102297 A	30-12-1998
		BR 9610208 A	02-02-1999
		CA 2227934 A	13-03-1997
		CZ 9800601 A	12-08-1998
		EP 0847394 A	17-06-1998
		HU 9802430 A	01-02-1999
		JP 2000026458 A	25-01-2000
		JP 3027196 B	27-03-2000
		JP 10510846 T	20-10-1998
		PL 325204 A	06-07-1998
		SK 24398 A	11-01-1999
		US 6054414 A	25-04-2000

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/04042

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES					
IPK 7	C07D249/18	C07D271/12	C07D285/14	C07D263/54	C07D277/62
	C07D235/04	A01N43/647	A01N43/78	A01N43/828	A01N43/76

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

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

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

EPD-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	Bef. Anspruch Nr.
X	EP 0 283 261 A (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC ET AL) 21. September 1988 (1988-09-21) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument, insbesondere Anspruch 5	1-15
X	WO 97 09324 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 13. März 1997 (1997-03-13) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-15

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

- | | |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :</p> <p>"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</p> <p>"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"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 angegeben)</p> <p>"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht</p> <p>"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</p> | <p>"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</p> <p>"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden</p> <p>"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</p> <p>"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</p> |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Abschließendes Datum des internationalen Recherchenberichts
27. Oktober 2000	30. 10. 2000

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

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/04042

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung		
EP 283261 A	21-09-1988	AT 110067 T	15-09-1994		
		AU 603648 B	22-11-1990		
		AU 1311388 A	22-09-1988		
		AU 602962 B	01-11-1990		
		AU 1328088 A	24-11-1988		
		BR 8801209 A	25-10-1988		
		CA 1340284 A	22-12-1998		
		DE 3851073 D	22-09-1994		
		DE 3851073 T	02-03-1995		
		EP 0283152 A	21-09-1988		
		ES 2058257 T	01-11-1994		
		HU 46881 A, B	28-12-1988		
		JP 63264542 A	01-11-1988		
		JP 1006256 A	10-01-1989		
		JP 2579663 B	05-02-1997		
		US 5958839 A	28-09-1999		
		US 5426091 A	20-06-1995		
		US 4912262 A	27-03-1990		
		US 5563115 A	08-10-1996		
		US 5041681 A	20-08-1991		
		US 5098464 A	24-03-1992		
		US 5744610 A	28-04-1998		
		US 5210312 A	11-05-1993		
		US 5250501 A	05-10-1993		
		YU 53988 A	28-02-1990		
		YU 165289 A	31-12-1990		
		ZA 8801483 A	30-11-1988		
		WO 9709324 A	13-03-1997	DE 19532311 A	06-03-1997
				AU 717015 B	16-03-2000
				AU 6929796 A	27-03-1997
BG 102297 A	30-12-1998				
BR 9610208 A	02-02-1999				
CA 2227934 A	13-03-1997				
CZ 9800601 A	12-08-1998				
EP 0847394 A	17-06-1998				
HU 9802430 A	01-02-1999				
JP 2000026458 A	25-01-2000				
JP 3027196 B	27-03-2000				
JP 10510846 T	20-10-1998				
PL 325204 A	06-07-1998				
SK 24398 A	11-01-1999				
US 6054414 A	25-04-2000				