

  
**PCT** WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
 Internationales Büro  
 INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
 INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

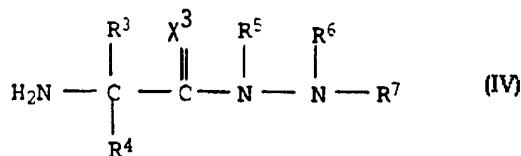
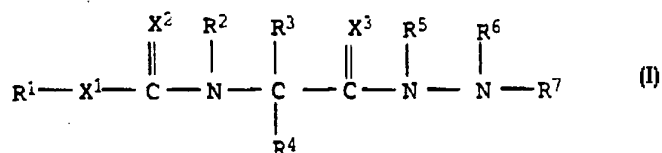
<p>(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> :  <b>C07C 271/22, 271/54, 271/34, 333/04, 271/60, 333/20, 243/38, A01N 47/12, 47/14, 47/18, 47/22, 47/24</b></p>	<p>A1</p>	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 95/33710</b></p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 14. December 1995 (14.12.95)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP95/01924</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 20. Mai 1995 (20.05.95)</p> <p>(30) Prioritätsdaten:          P 44 19 516.8 3. Juni 1994 (03.06.94) DE          195 04 423.1 10. Februar 1995 (10.02.95) DE</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(72) Erfinder; und</p> <p>(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): WAGNER, Oliver [DE/DE]; Siemensstrasse 1, D-66450 Bexbach (DE). WETTERICH, Frank [DE/DE]; Am Steinern Kreuz 16, D-64297 Darmstadt (DE). EICKEN, Karl [DE/DE]; Am Hüttenwingert 12, D-67157 Wachenheim (DE). AMMERMANN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2, D-64646 Heppenheim (DE). LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, D-67434 Hambach (DE). MÜLLER, Thomas [DE/DE]; Bergstrasse 19, D-67258 Heßheim (DE). SPEAKMAN, John-Bryan [GB/DE]; In den Hahndornen 7, D-67273 Bobenheim (DE).</p>	<p>(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, FI, HU, JP, KR, KZ, MX, NO, NZ, PL, RU, SG, SK, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p><b>Veröffentlicht</b>  <i>Mit internationalem Recherchenbericht.          Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i></p>	

(54) Title: CARBAMOYL CARBOXYLIC ACID HYDRAZIDES AND THEIR USE AGAINST FUNGI

(54) Bezeichnung: CARBAMOYL CARBONSÄUREHYDRAZIDE UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN

(57) Abstract

Disclosed are carbamoyl carboxylic acid hydrazides (I) and their salts, wherein: R<sup>1</sup> is optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, aryl or heteroaryl or an optionally substituted non-aromatic carbo- or heterocycle, W<sup>1</sup>W<sup>2</sup>C=N-, where W<sup>1</sup> is optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, aryl or heteroaryl and W<sup>2</sup> is hydrogen or W<sup>1</sup>; R<sup>2</sup> is hydrogen or optionally halogenated alkyl or cycloalkyl; R<sup>3</sup> is optionally substituted alkyl, cycloalkyl or phenylalkyl; R<sup>4</sup> is hydrogen or one of the R<sup>3</sup> radicals, or R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> together with the C atom to which they are bound form an optionally substituted saturated carbo- or heterocycle; R<sup>5</sup> is one of the R<sup>2</sup> radicals; R<sup>6</sup> is optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, aryl or heteroaryl, an optionally substituted non-aromatic carbo- or heterocycle or, when R<sup>3</sup> = isopropyl, hydrogen; R<sup>7</sup> is one of the R<sup>6</sup> radicals except hydrogen; X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup> and X<sup>3</sup> are in each case oxygen or sulfur. Disclosed also are methods for their preparation, agents that contain them, their use and intermediate products (IV), wherein X<sup>3</sup> is oxygen and R<sup>3</sup> is a CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> or CH(CH<sub>3</sub>)C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> group.



**(57) Zusammenfassung**

Carbamoylcarbonsäurehydrazide der allgemeinen Formel (I) sowie deren Salze, mit den Resten in den Bedeutungen: R<sup>1</sup> ggf. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heteroaryl oder einen gegebenenfalls substituierten nicht-aromatischen Carbo- oder Heterocyclus, W<sup>1</sup>W<sup>2</sup>C=N-, wobei W<sup>1</sup> ein ggf. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heteroaryl und W<sup>2</sup> Wasserstoff oder W<sup>1</sup> bedeutet; R<sup>2</sup> Wasserstoff oder ggf. halogeniertes Alkyl oder Cycloalkyl; R<sup>3</sup> ggf. substituiertes Alkyl, Cycloalkyl oder Phenylalkyl; R<sup>4</sup> Wasserstoff oder einen der Reste R<sup>3</sup> oder R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> zusammen mit dem C-Atom, an das sie gebunden sind, einen ggf. substituierten gesättigten Carbo- oder Heterocyclus; R<sup>5</sup> einen der Reste R<sup>2</sup>; R<sup>6</sup> ggf. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heteroaryl, einen gegebenenfalls substituierten nicht-aromatischen Carbo- oder Heterocyclus oder, im Falle von R<sup>3</sup> = iso-Propyl, Wasserstoff; R<sup>7</sup> einen der Reste R<sup>6</sup>, ausgenommen Wasserstoff, X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup> jeweils Sauerstoff oder Schwefel sowie Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel, ihre Verwendung und ferner Zwischenprodukte (IV), in denen X<sup>3</sup> für Sauerstoff steht und R<sup>3</sup> eine Gruppe CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder CH(CH<sub>3</sub>)C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> bedeutet.

**LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

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

AT	Österreich	GA	Gabon	MR	Mauretanien
AU	Australien	GB	Vereinigtes Königreich	MW	Malawi
BB	Barbados	GE	Georgien	NE	Niger
BE	Belgien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BJ	Benin	IE	Irland	PL	Polen
BR	Brasilien	IT	Italien	PT	Portugal
BY	Belarus	JP	Japan	RO	Rumänien
CA	Kanada	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CG	Kongo	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CH	Schweiz	KR	Republik Korea	SI	Slowenien
CI	Côte d'Ivoire	KZ	Kasachstan	SK	Slowakei
CM	Kamerun	LI	Liechtenstein	SN	Senegal
CN	China	LK	Sri Lanka	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
ES	Spanien	MG	Madagaskar	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	ML	Mali	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MN	Mongolei	VN	Vietnam

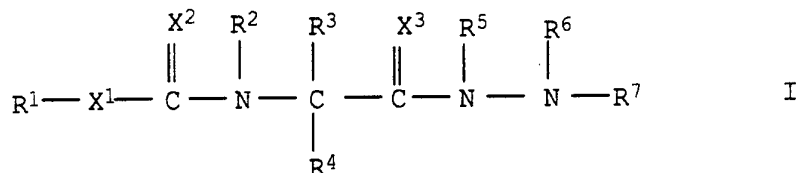
# CARBAMOYL CARBONSÄUREHYDRAZIDE UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft Carbamoylcarbonsäurehydrazide der allgemeinen Formel I

10



15

sowie deren Salze, in denen die Reste die folgende Bedeutung haben:

20  $R^1$  C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl,

25 Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl,

30

C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,

35 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl, Aryloxy und Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die cyclischen Gruppen einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl,

40 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy,

einen nicht-aromatischen 4- bis 8-gliedrigen Ring, welcher als Ringglieder neben Kohlenstoff noch eines oder zwei der Heteroatome Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann, wobei die Kohlenstoffatome im Ring eine oder zwei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,

45

## 2

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Aryl und Aryloxy und wobei das zweite und jedes weitere Stickstoffatom als Heteroatom im Ring Wasserstoff oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylgruppe trägt,

5

Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, in denen die cyclischen Substituenten ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl oder

10

15

W<sup>1</sup>W<sup>2</sup>C=N-, wobei

W<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl bedeutet, welches partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Aryl und Aryloxy,

20

25

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Aryl und Aryloxy, wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Aryl und Aryloxy,

30

35

C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Aryl und Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die Gruppen, welche Aryl enthalten, einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,

40

45

## 3

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy oder

- 5 Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy und
- 10 W<sup>2</sup> Wasserstoff oder eine der Gruppen W<sup>1</sup>;
- R<sup>2</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, welche partiell oder vollständig halogeniert sein können;
- 15 R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, wobei dieser Rest eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl,
- 20 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die Ringe dieser Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy;
- 25 R<sup>4</sup> Wasserstoff oder einen der Reste R<sup>3</sup> oder
- R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> gemeinsam mit dem C-Atom, an das sie gebunden sind, einen 4- bis 8-gliedrigen Ring, welcher als Ringglieder neben Kohlenstoff noch ein oder zwei der Heteroatome Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann, wobei die Kohlenstoffatome im Ring eine oder zwei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy und
- 30 wobei Stickstoff als Heteroatom Wasserstoff oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylgruppe trägt;
- 35 R<sup>5</sup> einen der Reste R<sup>2</sup>;
- 40 R<sup>6</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, Aryl, Aryloxy und
- 45 Heteroaryl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl,

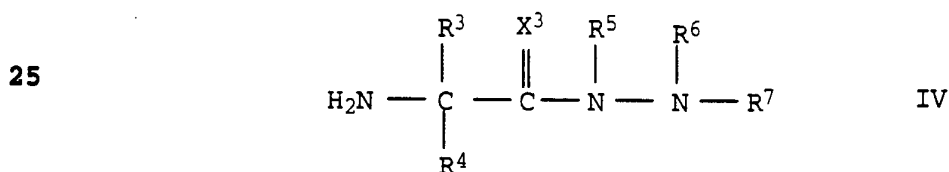
- 5 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die cyclischen Gruppen einen bis
- 10 drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl und Aryloxy,
- 15 einen nicht-aromatischen 4- bis 8-gliedrigen Ring, welcher als Ringglieder neben Kohlenstoff noch eines oder zwei der Heteroatome Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann, wobei die Kohlenstoffatome im Ring eine oder zwei der
- 20 folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl und Aryloxy und wobei das zweite und jedes weitere Stickstoffatom als Heteroatom im Ring Wasserstoff oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylgruppe trägt,
- 25 Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, in denen die cyclischen Substituenten ihrerseits
- 30 einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder
- 35 wenn R<sup>3</sup> für iso-Propyl steht, Wasserstoff;
- R<sup>7</sup> einen der Reste R<sup>6</sup>, ausgenommen Wasserstoff;
- X<sup>1</sup> Sauerstoff oder Schwefel,
- 40 X<sup>2</sup> Sauerstoff oder Schwefel,
- X<sup>3</sup> Sauerstoff oder Schwefel;
- ausgenommen die Verbindungen gemäß folgender Definition der Reste:
- 45 Ia-d (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl),

## 5

- Ie-h (R<sup>1</sup> = C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br),
- Ii (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH<sub>3</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup> = CH<sub>3</sub>; R<sup>7</sup> = Ph),
- 5 Ij-k (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = Ph),
- Il (R<sup>1</sup> = C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> = H; R<sup>7</sup> = Ph),
- Im (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>),
- 10 In-o (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> oder CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl).

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung der  
 15 Verbindungen I und ihrer Salze, diese Stoffe enthaltende Mittel sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen und die Verwendung dieser Stoffe hierzu.

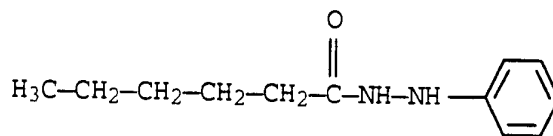
Des weiteren betrifft die vorliegende Erfindung Aminosäurehydra-  
 20 zid-Zwischenprodukte der allgemeinen Formel IV



30 in der X<sup>3</sup> für Sauerstoff und R<sup>3</sup> für eine Gruppe CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder CH(CH<sub>3</sub>)C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> steht und R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, ausgenommen die Verbindungen gemäß folgender Definition der Reste:

- 35 IVa-b (R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl),
- IVc-e (R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> oder CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br),
- IVf (R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> = H; R<sup>7</sup> = Ph),
- 40 IVg (R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = Ph).

Aus der DE-B 1 199 540 sind Mittel bekannt, welche Alkylcarbon-  
 säurehydrazide, z.B. die Verbindung folgender Formel



5

enthalten und welche eine Wirkung gegen echte Mehлтаupilze aufweisen.

- 10 Ferner lehrt die JP-A 69/27 997 die Verwendung von 4-Methoxycarbonylterephthalsäurehydrazid bzw. Terephthalsäurebishydrazid zur Bekämpfung von Reisbrand.

Diese Mittel vermögen jedoch als Fungizide noch nicht zu befriedigen.

- Aus der Literatur sind noch weitere Carbonsäurehydrazide bekannt; von einer fungiziden Wirkung dieser Verbindungen wird jedoch nichts berichtet (vgl. Pharmazie 44, Seite 608 bis Seite 611 (1989); Pharmazie 44, Seite 316 bis Seite 317 (1989); J. Org. Chem. 36, Seite 1580 bis Seite 1584 (1971); Farm. Pol. 28, Seite 615 (1972); EP-A 361 977; Collect. Czech. Commun. 49, Seite 2551 bis Seite 2561 (1989)).

- 25 Der vorliegenden Erfindung lagen daher neue Carbamoylcarbonsäurehydrazide mit verbesserter Wirkung gegen Schadpilze als Aufgabe zugrunde.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen I und ihre Salze gefunden.

Weiterhin wurden die für die Herstellung dieser Stoffe wichtigen Zwischenprodukte der allgemeinen Formel IV gefunden.

- 35 Ferner wurden sie enthaltende Mittel, Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I und ihrer Salze und der sie enthaltenden Mittel gefunden und des weiteren ein Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen und die Verwendung der Verbindungen I und ihrer Salze hierzu.

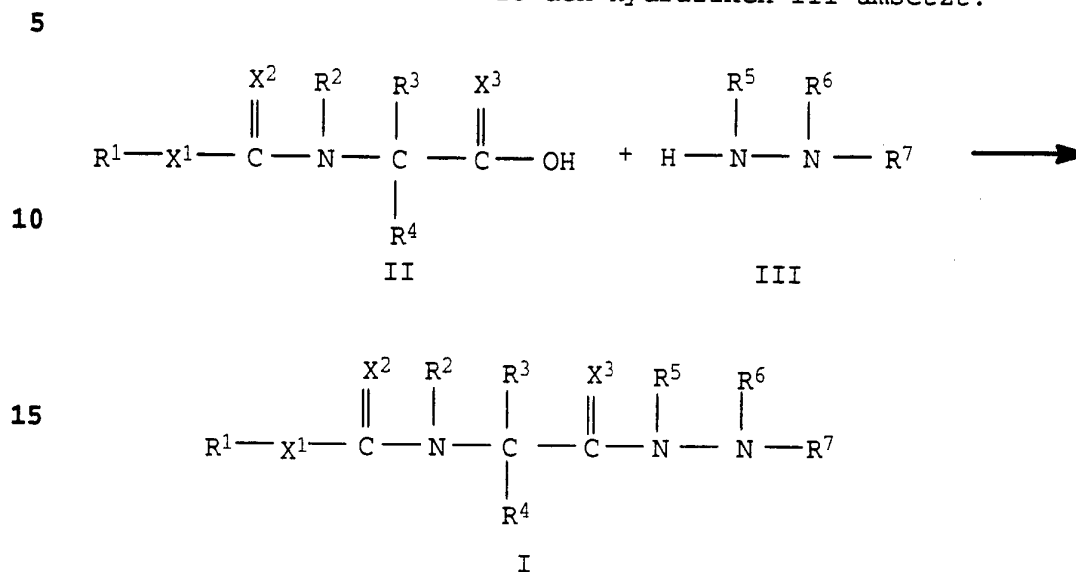
40

Die Verbindungen I und ihre Salze können ausgehend von den entsprechenden Carbamoylcarbonsäuren II hergestellt werden. Bevorzugt erhält man sie nach den im folgenden beschriebenen Verfahren A, B bzw. C (die Literaturzitate "Houben-Weyl" beziehen sich auf:

- 45 Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, 4. Auflage, Thieme Verlag, Stuttgart).

## Verfahren A

Die Carbamoylcarbonsäurehydrazide I erhält man, indem man die Carbamoylcarbonsäuren II mit den Hydrazinen III umsetzt.



Die Carbamoylcarbonsäuren II sind bekannt oder nach bekannten Methoden, vor allem ausgehend von den zugrundeliegenden Aminosäuren, erhältlich (vgl. z.B. Houben-Weyl "Methoden der organischen Chemie" Band 15/1, 4. Auflage, Thieme Verlag Stuttgart 1977;

- 25 JP 53148530; JP 52151146; J. Org. Chem. 43, 2930-2932 [1978]; J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1972, 1983-1985; Chem. Ber. 104, 3156-3167 [1971]; J. Org. Chem. 36, 49-59 [1971]; Helv. Chim. Acta 52, 282-291 [1969]; Tetrahedron 34, 2763-2766 [1978]; Chem. Pharm. Bull. 19, 912-929 [1971]; J. Chem. Soc. 1952, 2076-2079).

30

Die Hydrazine III sind ebenfalls bekannt oder leicht erhältlich (vgl. "Houben-Weyl", Band 10/2, Seite 1 bis Seite 71 bzw. Seite 169 bis Seite 409, vor allem Seite 396 bis Seite 399 und Seite 402 bis Seite 405).

35

Vorzugsweise arbeitet man in diesem Verfahren A so, daß man zunächst die Carbamoylcarbonsäuren II in carboxyaktivierte Derivate, vor allem in Acylcyanide oder Anhydride, überführt (vgl. Pharmazie 44, Seite 316 bis Seite 317 bzw. Seite 608 bis

40 Seite 611 (1989); Tetrahedron Letters, Band 18, Seite 1595 bis Seite 1598 (1973) bzw. "Houben-Weyl", Band 15/1, Seite 28 bis Seite 32). Diese Derivate werden dann mit den Hydrazinen III in Gegenwart von Basen zur Reaktion gebracht.

45

Zur Herstellung der carboxyaktivierten Acylcyanide eignet sich z.B. die Reaktion der Carbamoylcarbonsäuren II mit Cyanphosphonsäurediethylester, vor allem in einem inerten Lösungsmittel wie Tetrahydrofuran, Toluol oder Dichlormethan.

5

Zur Herstellung der carboxyaktivierten Anhydride ist die Umsetzung der Carbamoylcarbonsäuren II mit Kohlensäurechloriden wie Chlorameisensäure-iso-butylester in Gegenwart von Basen und gegebenenfalls in einem inerten Lösungsmittel wie Toluol oder Tetrahydrofuran bevorzugt.

10

Die Umsetzung der Hydrazine III mit den carboxyaktivierten Carbamoylcarbonsäuren II erfolgt vorzugsweise in einem Lösungsmittel wie Dichlormethan, Tetrahydrofuran oder Toluol.

15

Als Basen können insbesondere die Hydrazine III selbst dienen, wobei man sie aus dem Rohprodukt üblicherweise zurückgewinnt.

In einer bevorzugten Ausführungsform dieser Verfahrensstufe werden die Carbamoylcarbonsäure II, das Hydrazin III, das zur Erzeugung des carboxyaktivierten Derivates der Carbamoylcarbonsäure II geeignete Reagenz und die Base im Eintopfverfahren, gegebenenfalls in einem inerten Lösungsmittel, zur Reaktion gebracht und das Rohprodukt anschließend in an sich bekannter Weise auf das Carbamoylcarbonsäurehydrazid I aufgearbeitet.

20

#### Verfahren B

Die Carbamoylcarbonsäurehydrazide I, in denen  $R^1$  für eine Gruppe  $-W^1W^2C=N-$  steht, erhält man ferner, indem man die Carbamoylcarbonsäurehydrazide I, in denen  $X^1$ ,  $X^2$  und  $X^3$  jeweils Sauerstoff bedeuten und die Gruppe  $R^1-X^1-(CO)$  für eine Schutzgruppe steht, die in an sich bekannter Weise abgespalten werden kann, in Carbonsäurehydrazide IV überführt und diese mit Chlorformyloximen V in Gegenwart von Basen umsetzt.

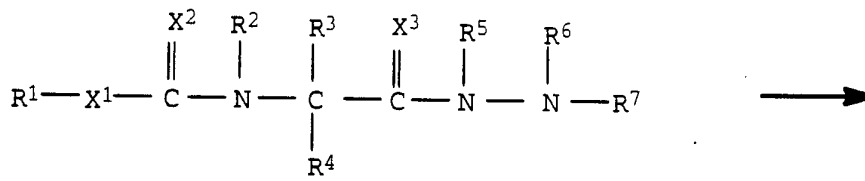
25

Stufe Ba: Herstellung der Carbonsäurehydrazide IV

40

45

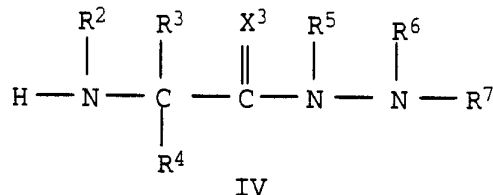
9



5

I

10



IV

15 Die Abspaltung der Gruppe  $R^1-X^1-(CO)$  aus den Carbamoylcarbonsäurehydraziden I kann in an sich bekannter Weise durchgeführt werden (vgl. "Houben-Weyl", Band 15/1, Seite 46 bis Seite 305, vor allem Seite 126 bis Seite 129; Pharmazie 44, Seite 316 bis Seite 317 (1989)).

20

Geeignete abspaltbare Gruppen enthalten als Rest  $R^1$  vor allem die tert.-Butyl-, und daneben die Benzylgruppe.

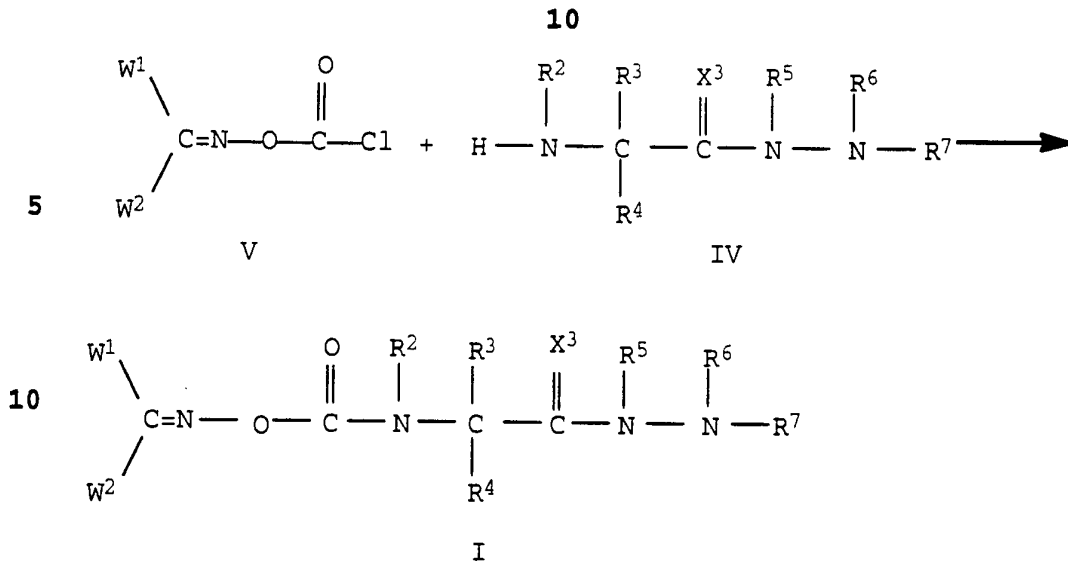
25 Im Falle von  $R^1 = \text{tert.-Butyl}$  beispielsweise erfolgt die Abspaltung üblicherweise durch Umsetzung mit einer Säure, insbesondere einer Protonensäure wie Salzsäure, Bromwasserstoffsäure oder Tri-fluoressigsäure (loc. cit.).

30 Die als Ausgangsstoffe geeigneten Carbamoylcarbonsäurehydrazide I sind nach bekannten Verfahren (vgl. Pharmazie 44, Seite 316 bis Seite 317 bzw. Seite 608 bis Seite 611 (1989); "Houben-Weyl", Band 15/1, Seite 28 bis Seite 32) oder insbesondere nach dem erfindungsgemäßen Verfahren A erhältlich.

35 Stufe Bb: Herstellung der Carbamoylcarbonsäurehydrazide I

40

45



15

Die aus der Synthesestufe (Ba) resultierenden Carbonsäurehydrazide IV werden mit den Chlorformyloximen V in Gegenwart von Basen umgesetzt.

20 Die Chlorformyloxime V sind bekannt oder nach bekannten Verfahren, z.B. durch Phosgenierung von Oximen, erhältlich (vgl. Z. Chem. 9, Seite 344 bis Seite 345 (1967)).

Die Umsetzung wird vorzugsweise in einem organischen Lösungsmittel, vor allem in Toluol, Methylenchlorid, Tetrahydrofuran oder Gemischen dieser Lösungsmittel durchgeführt.

Als Basen kommen anorganische und organische Basen gleichermaßen in Betracht, wobei organische Basen und hierunter wiederum tertiäre Amine wie Triethylamin, Pyridin und N-Methylpiperidin bevorzugt sind.

Die Umsetzung wird in der Regel bei Temperaturen von (-40) bis 50, vorzugsweise (-10) bis 20°C durchgeführt.

35

Im übrigen ist die Durchführung dieser Reaktion dem Fachmann geläufig, so daß es keiner weiteren Ausführungen hierzu bedarf (vgl. "Houben-Weyl", Band 15/1, Seite 117 bis Seite 125; Dev. Endocrinol. 13 (Neurohypophyseal Pept. Horm. Other Biol. Act.

40 Pept.), Seite 37 bis Seite 47 (1981)).

#### Verfahren C

Die Carbamoylcarbonsäurehydrazide der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1, in der R<sup>6</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl steht, sind ferner durch Umsetzung von Carbamoylcarbonsäurehydraziden der allgemeinen Formel I gemäß An-

## 11

spruch 1, in der R<sup>6</sup> Wasserstoff bedeutet, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel R<sup>6</sup>-X, in welcher R<sup>6</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl steht und X eine negative Abgangsgruppe bedeutet, unter Mitverwendung einer Base erhältlich.

Die Carbamoylcarbonsäurehydrazide der allgemeinen Formel I, in der R<sup>6</sup> für Wasserstoff steht sind in an sich bekannter Weise (vgl. DE-A 1 089 390; Zh. Org. Khim. 14, Seite 1086 (1978)), oder insbesondere nach dem erfindungsgemäßen Verfahren A erhältlich.

Als negative Abgangsgruppe X kommen das Methylsulfonyl-, das 4-Methylphenylsulfonylanion und vorzugsweise Halogenid-Anionen wie Jodid und insbesondere Chlorid und Bromid in Betracht.

15

Als Basen verwendet man vor allem Alkalimetallcarbonate und -alkanolate wie Natriumcarbonat, Natriummethanolat und Natriumethanolat, daneben Erdalkalimetallcarbonate wie Calciumcarbonat, Alkalimetall- oder Erdalkalimetallhydroxide, z.B. Natriumhydroxid und Calciumhydroxid, -hydride, z.B. Natriumhydrid, -hydrogencarbonate, z.B. Natriumhydrogencarbonat, -alkane, z.B. n-Butyllithium oder tertiäre Amine wie Triethylamin.

Die Reaktion kann lösungsmittelfrei oder in einem unter den Reaktionsbedingungen inerten Lösungsmittel wie Dimethylformamid, Tetrahydrofuran, Dichlormethan oder Alkanolen wie Methanol oder Ethanol durchgeführt werden.

Man führt die Reaktion in der Regel bei einer Temperatur von 10 bis 60°C und unter Normaldruck durch.

Im übrigen erfolgt die Durchführung des Verfahrens in an sich bekannter Weise (vgl. "Houben-Weyl", Band 10/2, Seite 402 bis Seite 404).

35

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

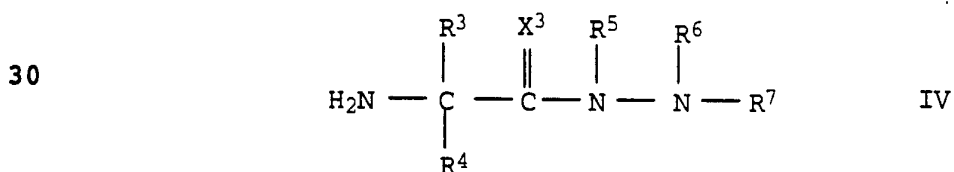
## 12

Die Verbindungen der Formel I können gegebenenfalls in Abhängigkeit von der Art der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere oder Isomerengemische vorliegen. Sowohl die reinen Isomeren als auch die Gemische der Isomeren weisen fungizide Wirkung auf.

Teil der Erfindung sind auch die Salze insbesondere der säurebeständigen Verbindungen I, welche basische Zentren, vor allem basische Stickstoffatome enthalten, und zwar insbesondere die Salze mit Mineralsäuren wie Schwefelsäure und Phosphorsäure oder Lewis-Säuren wie Zinkchlorid. Üblicherweise kommt es auf die Art des Salzes nicht an. Im Sinne der Erfindung sind solche Salze bevorzugt, die die von Schadpilzen freizuhaltenden Pflanzen, Flächen, Materialien oder Räume nicht schädigen und die Wirkung der Verbindungen I nicht beeinträchtigen.

Die Salze der Verbindungen I sind in an sich bekannter Weise zugänglich, vor allem durch Umsetzen der entsprechenden Carbamoylcarbonsäurehydrazide I mit den genannten Säuren in Wasser oder einem inerten organischen Lösungsmittel bei Temperaturen von -80 bis 120, vorzugsweise 0 bis 60°C.

Bei der Herstellung der Carbamoylcarbonsäurehydrazide I gemäß Verfahren B werden auch neue Zwischenprodukte der allgemeinen Formel IV erhalten



35 in der X<sup>3</sup> für Sauerstoff steht und R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, und R<sup>7</sup> die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und R<sup>3</sup> für eine Gruppe CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder CH(CH<sub>3</sub>)C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> steht, wobei die Verbindungen gemäß folgender Definition der Reste bereits bekannt sind:

40

IVa-b (R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl),

IVc-e (R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> oder CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br),

45 IVf (R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> = H; R<sup>7</sup> = Ph),

IVg (R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = Ph)

## 13

(vgl. Pharmazie, 44, Seite 608 bis Seite 611 (1989); Pharmazie, 44 Seite 316 bis Seite 317 (1989); EP-A 0 361 977; Int. J. Pept. Protein Res. 21 Seite 406 (1983); Farm. Pol. 28, Seite 615 bis Seite 619 (1972)).

5

Unter den neuen Aminosäurehydraziden IV sind jene bevorzugt, in denen R<sup>3</sup> für eine Gruppe CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> steht, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

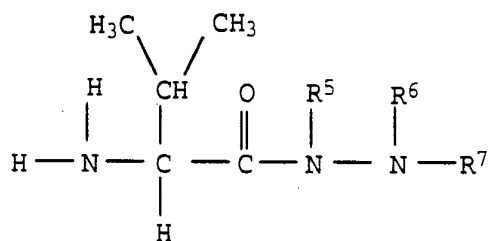
- 10 R<sup>6</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl steht, wobei dieser Rest partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits
- 15 einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl und
- 20 R<sup>7</sup> für Aryl steht, wobei dieser Rest eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, in denen die cyclischen Substituenten ihrerseits
- 25 einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio.

Besonders bevorzugt sind im Hinblick auf ihre Verwendung zur Herstellung der Carbamoylcarbonsäurehydrazide I die in den anschließenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen IV.

Tabelle 1

35

40



45

Nr.	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
1	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

Nr.	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
4	H	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
11	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl
12	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
13	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
14	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
16	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
17	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
18	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCH <sub>3</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
19	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
20	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
21	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
22	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
23	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
25	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
25	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
26	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
27	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
28	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
30	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
30	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
31	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
32	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
35	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
34	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
35	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
36	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
40	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
38	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
39	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
40	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
41	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
45	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

## 15

Bei der eingangs angegebenen Definition der Verbindungen I wurden Sammelbegriffe verwendet, die repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

5 Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, n-Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl,

- 10 1,1-Dimethylethyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 1,1-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl,
- 15 1,3-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halogenalkyl bzw. partiell oder vollständig halogeniertes Alkyl:

- 20 geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 bzw. 8 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome partiell oder vollständig durch Halogenatome (wie vorstehend genannt) ersetzt sein können, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl,
- 25 Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

30

Alkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, Propoxy und 1-Methylethoxy;

- 35 Alkoxyalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche in einer beliebigen Position eine geradkettige oder verzweigte Alkoxygruppe (wie vorstehend genannt) mit im Falle von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl 1 bis 4 Kohlenstoffatomen tragen, wie Methoxymethyl, Ethoxymethyl, n-Propoxymethyl, n-Butoxymethyl, 1-Methoxyethyl, 2-Methoxyethyl,
- 40 1-Ethoxyethyl, 2-Ethoxyethyl, 2-n-Propoxyethyl und 2-Butoxyethyl;

Halogenalkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen

- 45 Gruppen die Wasserstoffatome partiell oder vollständig durch Halogenatome (wie vorstehend genannt) ersetzt sein können, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy wie Chlormethoxy, Dichlormethoxy, Tri-

## 16

- chlormethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlorfluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 1-Fluorethyloxy, 2-Fluorethyloxy, 2,2-Difluorethyloxy, 2,2,2-Trifluorethyloxy, 2-Chlor-2-fluorethyloxy,
- 5 2-Chlor-2,2-difluorethyloxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethyloxy, 2,2,2-Trichlorethyloxy und Pentafluorethyloxy;

- Alkylthio: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein
- 10 Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, n-Butylthio und tert.-Butylthio;

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

- Alkenyl: geradkettige oder verzweigte Alkenylgruppen mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen
- 20 Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-
- 25 1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl,
- 30 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl,
- 35 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl,
- 40 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und
- 45 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

## 17

- Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Alkynylgruppen mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
- 15  
Cycloalkyl: monocyclische Alkylgruppen mit 3 bis 7 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl;
- 20 Cycloalkenyl: monocyclische Alkylgruppen mit 5 bis 7 Kohlenstoffringgliedern die eine oder mehrere Doppelbindungen enthalten z.B. C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl wie Cyclopentenyl, Cyclohexenyl und Cycloheptenyl;
- 25 nicht-aromatische 4- bis 8-gliedrigen Ringe, welcher als Ringglieder neben Kohlenstoff noch ein oder zwei Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoffatome enthalten wie gesättigte 5- oder 6-gliedrige Ringe mit 1 oder 2 Stickstoff- und/oder Sauerstoffatomen wie 3-Tetrahydrofuranlyl, 1-Piperidinyl, 2-Piperidinyl,
- 30 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 2-Tetrahydropyranlyl, 3-Tetrahydropyranlyl, 4-Tetrahydropyranlyl, 2-Morpholinyl und 3-Morpholinyl;
- Aryl: monocyclische oder polycyclische aromatische Gruppen mit 6 bis 10 C-Atomen wie Phenyl und Naphthyl;
- 35  
Arylalkyl: Arylgruppen (wie vorstehend genannt), welche im Falle von Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl über Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt) an das Gerüst gebunden sind, z.B. Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl wie Benzyl, 2-Phenylethyl, 3-Phenylpropyl,
- 40 4-Phenylbutyl, 1-Phenylethyl, 1-Phenylpropyl und 1-Phenylbutyl;
- Aryloxy: Arylgruppen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind wie Phenoxy, 1-Naphthoxy und 2-Naphthoxy;

## 18

Heteroaryl: aromatische mono- oder polycyclische Reste, welche neben Kohlenstoffringgliedern zusätzlich 1 bis 4 Stickstoffatome oder 1 bis 3 Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom enthalten  
5 können, z.B.:

- 10 - 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend 1 bis 3 Stickstoffatome: 5-Ring-Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen 1 bis 3 Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Triazol-3-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 15 - 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend 1 bis 4 Stickstoffatome oder 1 bis 3 Stickstoffatome und 1 Schwefelatom oder Sauerstoffatom oder 1 Sauerstoff- oder 1 Schwefelatom: 5-Ring-Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen 1 bis 4 Stickstoffatome oder 1 bis 3 Stickstoffatome und 1 Schwefel- oder Sauerstoffatom oder 1 Sauerstoff- oder Schwefelatom als  
20 Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl, 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 30 - benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend 1 bis 3 Stickstoffatome oder 1 Stickstoffatom und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom: 5-Ring-Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen 1 bis 4 Stickstoffatome oder 1 bis 3 Stickstoffatome und 1 Schwefel- oder Sauerstoffatom oder 1  
35 Sauerstoff- oder ein Schwefelatom als Ringglieder enthalten können, und in welchen 2 benachbarte Kohlenstoffringglieder oder 1 Stickstoff- und 1 benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können;
- 40 - über Stickstoff gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend 1 bis 4 Stickstoffatome, oder über Stickstoff gebundenes benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend 1 bis 3 Stickstoffatome: 5-Ring-Heteroarylgruppen, welche neben  
45 Kohlenstoffatomen 1 bis 4 Stickstoffatome bzw. 1 bis 3 Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, und in welchen 2 benachbarte Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und

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

- 5
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend 1 bis 3 bzw. 1 bis 4 Stickstoffatome: 6-Ring-Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen 1 bis 3 bzw. 1 bis 4 Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 10 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl und 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl;
- benzokondensiertes 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend 1 bis 15 4 Stickstoffatome: 6-Ring-Heteroarylgruppen, in welchen 2 benachbarte Kohlenstoffringglieder durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können, z.B. Chinolin, Isochinolin, Chinazolin und Chinoxalin.
- 20 Die Angabe "partiell oder vollständig halogeniert" soll zum Ausdruck bringen, daß in den derart charakterisierten Gruppen die Wasserstoffatome zum Teil oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome, wie vorstehend genannt, ersetzt sein können.
- 25 Im Hinblick auf ihre biologische Wirkung gegen Schadpilze sind Verbindungen I bevorzugt, in denen
- R<sup>7</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl bedeutet, wobei diese 30 Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die cyclischen Gruppen 35 einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl und Aryloxy oder
- 40 R<sup>7</sup> einen nicht-aromatischen 4- bis 8-gliedrigen Ring bedeutet, welcher als Ringglieder neben Kohlenstoff noch eines oder zwei der Heteroatome Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann, wobei die Kohlenstoffatome im Ring eine oder zwei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, 45 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl und Aryloxy und wobei das zweite und jedes weitere Stickstoffatom

als Heteroatom im Ring Wasserstoff oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylgruppe trägt oder

- 5 R<sup>7</sup> Aryl oder Heteroaryl bedeutet, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, in denen die cyclischen Substituenten ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen
- 10 können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen die Reste die

15 folgenden Bedeutungen haben, und zwar für sich allein oder in Kombination:

- 20 R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, wobei dieser Rest eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Phenyl und Phenoxy, vor allem C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und Benzyl,
- 25 R<sup>1</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, wobei dieser Rest eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, Phenyl und Phenoxy und vor allem Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl,
- 30 R<sup>1</sup> Aryl, wobei dieser Rest eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, vor allem Phenyl und Naphthyl, welche unsubstituiert sein und/oder ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propyloxy, iso-Propyloxy, n-Butyloxy und iso-Butyloxy und tert.-Butyloxy sowie insbesondere unsubstituiertes Phenyl, 1-Naphthyl und
- 35 2-Naphthyl,
- R<sup>2</sup> Wasserstoff,
- R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, vor allem C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,
- 40 R<sup>3</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, vor allem Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,
- R<sup>4</sup> Wasserstoff,
- 45 R<sup>4</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, vor allem C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,

## 21

- R<sup>4</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, vor allem Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,
- R<sup>4</sup> Wasserstoff,
- 5** R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl und R<sup>4</sup> Wasserstoff,
- R<sup>5</sup> Wasserstoff,
- 10** R<sup>3</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl und R<sup>4</sup> Wasserstoff,
- R<sup>5</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, vor allem Methyl oder Ethyl,
- R<sup>5</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, vor allem Cyclopropyl,
- 15** R<sup>6</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, vor allem Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl,
- R<sup>6</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl,
- 20** R<sup>6</sup> Aryl, wobei dieser Rest unsubstituiert sein oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propyloxy, iso-Propyloxy, n-Butyloxy, iso-Butyloxy, tert.-Butyloxy, Trifluormethoxy, Phenyl und Phenoxy,
- 25** R<sup>7</sup> Phenyl, wobei dieser Rest unsubstituiert sein oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propyloxy, iso-Propyloxy, n-Butyloxy, iso-Butyloxy, tert.-Butyloxy, Trifluormethoxy, Phenyl und Phenoxy,
- 30** R<sup>7</sup> Naphthyl, wobei dieser Rest unsubstituiert sein oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propyloxy, iso-Propyloxy, n-Butyloxy, iso-Butyloxy, tert.-Butyloxy, Trifluormethoxy, Phenyl und Phenoxy,
- 35** R<sup>7</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, wobei dieser Rest unsubstituiert sein oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, vor allem derart substituiertes C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>- und insbesondere C<sub>6</sub>-Cycloalkyl.
- 40**

Bezüglich der Bedeutung von X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup> und X<sup>3</sup> sind besonders bevorzugt

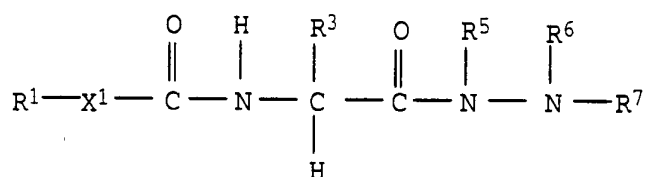
**45** Verbindungen I, in denen X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup> und X<sup>3</sup> für Sauerstoff steht. Falls eine oder mehrere von X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup> und X<sup>3</sup> Schwefel bedeuten, sind solche Verbindungen I bevorzugt, in denen X<sup>1</sup> und X<sup>2</sup> Schwefel bedeuten,

insbesondere solche, in denen nur X<sup>1</sup> Schwefel bedeutet. Es können jedoch auch solche Verbindungen I bevorzugt sein, in denen nur X<sup>2</sup> Schwefel bedeutet.

5 Ganz besonders bevorzugt sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den anschließenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I.

Tabelle 2

10



15

X<sup>1</sup> steht für Sauerstoff oder Schwefel.

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
1	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
12	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
13	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
14	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
15	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
16	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
19	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
20	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
21	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
22	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
23	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
24	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
25	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
5	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (4-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
20	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
25	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
30	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
35	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
40	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
45	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

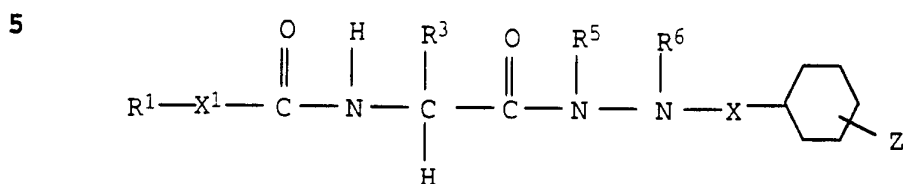
Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2,3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
20	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
25	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
30	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
35	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
40	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH <sub>2</sub> -(4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
45	CH <sub>2</sub> -(4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH <sub>2</sub> -(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
108	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
109	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5 110	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
111	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
112	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
113	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
114	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10 115	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
116	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
117	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
118	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15 119	(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
120	ClCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
121	Cl <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
122	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
123	CH <sub>2</sub> =CH	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
20 124	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
125	Cl(CH <sub>3</sub> )CH	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
126	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
127	CH <sub>2</sub> =C(CH <sub>3</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
25 128	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
129	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
130	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
131	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
132	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
30 133	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
134	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
135	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
136	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
35 137	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
138	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
139	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
140	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
141	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
40 142	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
143	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
144	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
145	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
45 146	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
147	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
148	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
149	CH <sub>2</sub> -(4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
150	CH <sub>2</sub> -(4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
151	CH <sub>2</sub> -(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
152	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
153	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
154	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
155	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
156	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
157	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
158	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
159	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
160	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
161	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
162	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
163	(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
164	ClCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
165	Cl <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
166	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
167	CH <sub>2</sub> =CH	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
168	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
169	Cl(CH <sub>3</sub> )CH	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
170	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
171	CH <sub>2</sub> =C(CH <sub>3</sub> )	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
172	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
173	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
174	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
175	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
176	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
172	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
173	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
174	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
175	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
176	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
177	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
178	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
179	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
180	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
181	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
182	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
183	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
184	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H
	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
20	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
25	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	n-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	n-C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
30	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
35	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	n-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	n-C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
40	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

Tabelle 3



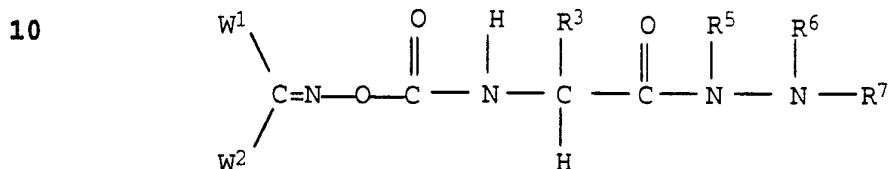
10

X<sup>1</sup> steht für Sauerstoff oder Schwefel.

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Z	
1	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-Cl	
15	2	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	
3	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-OCH <sub>3</sub>	
4	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
5	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	H	
20	6	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl	
7	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-CH <sub>3</sub>	
8	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-OCH <sub>3</sub>	
9	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	3,4-(OCH <sub>3</sub> )	
25	10	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	
11	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-Cl	
12	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-CH <sub>3</sub>	
13	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-OCH <sub>3</sub>	
14	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
30	15	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Cl
16	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	4-Cl	
17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCH <sub>3</sub>	4-Cl	
18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl	
35	19	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-	4-Cl
20	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	-	4-Cl	
21	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-	4-Cl	
22	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
40	23	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-	4-Cl
24	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-	4-CH <sub>3</sub>	
25	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-	4-OCH <sub>3</sub>	
26	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
45	27	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-Cl
28	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-Cl	
29	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	-	4-Cl	

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Z
30	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	4-Cl
31	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	4-CH <sub>3</sub>
32	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	4-OCH <sub>3</sub>

Tabelle 4



15

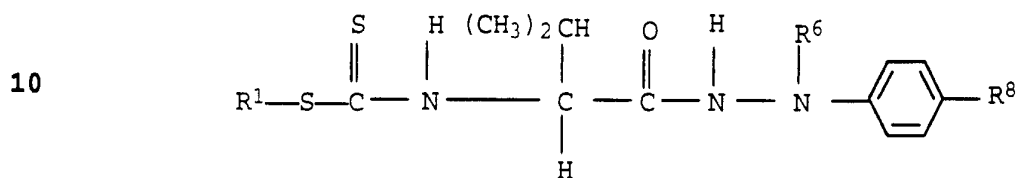
Nr.	W <sup>1</sup>	W <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
12	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
13	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
14	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
16	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
17	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
18	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
19	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
20	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
21	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
22	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> (4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
23	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
24	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
25	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )

30

Nr.	W <sup>1</sup>	W <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
26	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
27	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

5

Tabelle 5



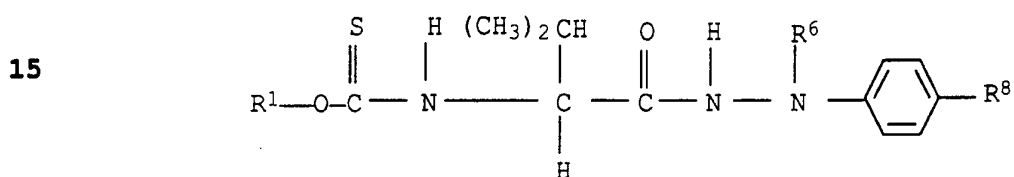
15

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>8</sup>	
1	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
2	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	
3	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
20	4	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	
5	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
6	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	
7	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	
25	8	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	
9	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	
10	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	
11	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	
30	12	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl
13	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	
14	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	
15	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	
35	16	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl
17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	
18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	
19	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	
20	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	
40	21	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
22	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	Cl	
23	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	Cl	
24	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	Cl	
45	25	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>
26	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	
27	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	

## 31

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>8</sup>
28	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Cl
29	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Cl
5 30	CH(CH <sub>3</sub> )QH <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Cl
31	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
32	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl
33	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
10 34	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl

Tabelle 6



20

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>8</sup>
1	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
2	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl
25 3	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl
5	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
6	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl
7	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
30 8	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl
9	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
10	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl
11	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
35 12	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl
13	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
14	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl
15	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
40 16	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl
17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl
19	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
20	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
45 21	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
22	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	Cl

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>8</sup>
23	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	Cl
24	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	Cl
5 25	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>
26	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>
27	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>
28	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Cl
10 29	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Cl
30	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Cl
31	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
32	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl
33	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
15 34	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl

Die neuen Verbindungen der Formel I eignen sich als Fungizide.

20 Die neuen Verbindungen, bzw. die sie enthaltenden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch  
 25 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.

30 Normalerweise werden die Pflanzen mit den Wirkstoffen besprüht oder bestäubt oder die Samen der Pflanzen mit den Wirkstoffen behandelt.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder  
 35 Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfs-  
 40 lösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und  
 45 Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-  
 ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fett-

alkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose.

- Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-,  
5 Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate  
10 mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes iso-Octyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkyl-  
15 arylpolyetheralkohole, iso-Tridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.
- 20  
Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.
- 25 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde,  
30 Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.
- 35  
Beispiele für solche Zubereitungen sind:
- I. eine Lösung aus 90 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen  
40 Verbindung I und 10 Gew.-Teilen N-Methyl-2-pyrrolidon, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist;
- II. eine Mischung aus 10 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen  
45 Verbindung I, 70 Gew.-Teilen Xylol, 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl;

durch feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine Dispersion.

- 5 III. eine wäßrige Dispersion aus 10 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen iso-Butanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol Ricinusöl;
- 10 IV. eine wäßrige Dispersion aus 10 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 25 Gew.-Teilen Cyclohexanol, 55 Gew.-Teilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol Ricinusöl;
- 15 V. eine in einer Hammermühle vermahlene Mischung aus 80 Gew.-Teilen, vorzugsweise einer festen erfindungsgemäßen Verbindung I, 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Di-isobutyl-naphthalin-2-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-ablage und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel; durch feines Verteilen der Mischung in Wasser erhält man eine Spritzbrühe;
- 20 VI. eine innige Mischung aus 3 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I und 97 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin; dieses Stäubemittel enthält 3 Gew.-% Wirkstoff;
- 30 VII. eine innige Mischung aus 30 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 62 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde; diese Aufbereitung gibt dem Wirkstoff eine gute Haftfähigkeit;
- 35 VIII. eine stabile wäßrige Dispersion aus 40 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes eines Phenolsulfonsäure-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates, 2 Gew.-Teilen Kieselgel und 48 Gew.-Teilen Wasser, die weiter verdünnt werden kann;
- 40 IX. eine stabile ölige Dispersion aus 20 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 2 Gew.-Teilen des Calciumsalzes der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gew.-Teilen Fettalkoholpolyglykoether, 20 Gew.-Teilen des Natriumsalzes eines Phenolsulfonsäure-Harnstoff-Formaldehyd-Kon-
- 45

densates und 50 Gew.-Teilen eines paraffinischen Mineralöls.

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

10

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

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

Die Anwendung erfolgt vor oder nach der Infektion der  
Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze.

25

Speziell eignen sich die neuen Verbindungen zur Bekämpfung  
folgender Pflanzenkrankheiten:

Erysiphe graminis (echter Mehltau) in Getreide, Erysiphe  
30 cichoracearum und Sphaerotheca fuliginea an Kürbisgewächsen,  
Podosphaera leucotricha an Äpfeln, Uncinula necator an Reben,  
Puccinia-Arten an Getreide, Rhizoctonia-Arten an Baumwolle und  
Rasen, Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr, Venturia  
inaequalis (Schorf) an Äpfeln, Helminthosporium-Arten an  
35 Getreide, Septoria nodorum an Weizen, Botrytis cinerea (Grau-  
schimmel) an Erdbeeren, Reben, Zierpflanzen und Gemüse,  
Cercospora arachidicola an Erdnüssen, Pseudocercospora  
herpotrichoides an Weizen, Gerste, Pyricularia oryzae an Reis,  
Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten, Fusarium- und  
40 Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen, Plasmopara viticola  
an Reben, Alternaria-Arten an Gemüse und Obst.

Die neuen Verbindungen können auch im Materialschutz (Holzschutz)  
eingesetzt werden, z.B. gegen Paecilomyces variotii.

45

## 36

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

Die Aufwandmengen liegen je nach Art des gewünschten Effektes  
5 zwischen 0,025 und 2, vorzugsweise 0,1 bis 1 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50, vorzugsweise 0,01 bis 10 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

10

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln.

15

Beim Vermischen mit Fungiziden erhält man dabei in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

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

Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyl-  
dithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithio-  
25 carbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zink-ethylen-  
diamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-  
Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-  
Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-  
propylen-bis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thio-  
30 carbamoyl)-disulfid;

Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat,  
2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec.-  
Butyl-4,6-dinitrophenyl-iso-propylcarbonat, 5-Nitro-iso-phthal-  
35 säure-di-iso-propylester;

heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat,  
2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthal-  
imidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-  
40 3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon,  
2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benz-  
imidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benz-  
imidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benz-  
imidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid,  
45 N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-  
phthalimid,

- N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäure-diamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodan-methylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazon, Pyridin-
- 5 2-thion-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Di-hydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid,
- 10 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-(1-(2,2,2-trichlor-ethyl)-formamid,
- 15 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan,
- 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Di-methyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethylmorpholin,
- 20 N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-di-oxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-tri-chlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-
- 25 3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, (2-Chlor-phenyl)-(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethyl-amino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyri-dinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, [2-(4-Chlor-
- 30 phenyl)ethyl]-(1,1-dimethylethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, 1-[3-(2-Chlorphenyl)-1-(4-fluorphenyl)oxiran-2-yl-methyl]-1H-1,2,4-triazol sowie
- verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-(3,5-Di-
- 35 methyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]glutarimid, Hexachlor-benzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methyl-ester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrol-acton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethyl-
- 40 ester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxa-zolidin, 3-[(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxa-zolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-iso-propylcarbamoyl-hydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbon-säureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-meth-
- 45 oximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-tri-azol, 2,4-Difluor- $\alpha$ -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalko-hol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluor-

## 38

methyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol,

Strobilurine wie Methyl-E-methoximino-[ $\alpha$ -(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetat, Methyl-E-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy)pyridimin-4-yl-oxy]phenyl}-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoximino-[ $\alpha$ -(2,5-dimethyloxy)-o-tolyl]acetamid.

Anilino-Pyrimidine wie N-(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)anilin, N-[4-methyl-6-(1-propinyl)pyrimidin-2-yl]anilin, N-(4-methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl)anilin.

Phenylpyrrole wie 4-(2,2-difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril.

Zimtsäureamide wie 3-(4-chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)acrylsäuremorpholid.

## Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften können unter Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Vertreter der Verbindungen IV bzw. I benutzt werden. Die physikalischen Daten der demgemäß hergestellten Produkte sind in den jeweils anschließenden Tabellen wiedergegeben.

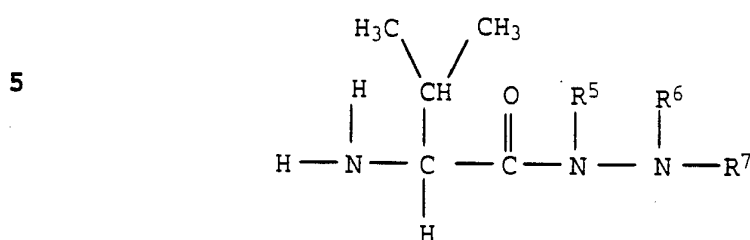
## Beispiel 1

L-Valin-[(2-methyl-2-(4-methylphenylhydrazid)]

Zu 1 g (3 mmol) N <sup>$\alpha$</sup> -(tert.-Butyloxycarbonyl)-L-valin-[(2-methyl-2-(4-methylphenyl)]-hydrazid wurden unter Kühlung 10 ml Trifluoressigsäure gegeben und die Mischung eine Stunde bei 0°C nachgerührt. Anschließend wurde auf 20°C erwärmt, die Trifluoressigsäure weitgehend abdestilliert und der Rückstand in Dichlormethan aufgenommen. Die organische Phase wurde mit jeweils 40 ml 10 gew.-%iger Natronlauge und Wasser gewaschen und getrocknet. Danach wurde das Lösungsmittel entfernt. Es verblieben 0,7 g L-Valin-[(2-methyl-2-(4-methylphenylhydrazid)], welches ohne Reinigung in der Folgestufe verwendet wurde.

In analoger Weise wurden die in der folgenden Tabelle aufgeführten Zwischenprodukte IV des Typs dargestellt.

Tabelle 7



10

Nr.	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Fp. (°C)/IR (cm <sup>-1</sup> )
1	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	Öl
2	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	Öl
15 3	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	3245, 2964, 2934, 2872, 1669, 1493
4	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	3250, 2963, 2931, 2871, 1673, 1512

## Beispiel 2

20

N<sup>α</sup>-(sec.-Butyloxycarbonyl)-L-valin-[2-methyl-2-(4-methylphenyl)]-hydrazid

Zu 0,7 g (3 mmol) L-Valin-[2-methyl-2-(4-methylphenyl)]-hydrazid und 0,32 g (3,2 mmol) Triethylamin in 10 ml Toluol wurden bei 0°C 0,39 g (2,9 mmol) Chlorameisensäure-sec.-butylester getropft. Nach 15 Stunden bei 20°C wurde die organische Phase mit jeweils 20 ml 10 gew.-%iger Salzsäure, Natriumhydrogencarbonat-Lösung und Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde getrocknet und danach das Lösungsmittel entfernt. Es verblieben 0,6 g der Titelverbindung als Öl (Verbindung 6 in Tabelle 6).

## Beispiel 3

35 N<sup>α</sup>-(tert.-Butyloxycarbonyl)-L-valin-[2-methyl-2-(4-chlorphenyl)]-hydrazid

Zu 10,9 g (0,05 mol) tert.-Butyloxycarbonyl-L-valin in 200 ml Dimethylformamid wurden bei -15°C 5 g (0,05 mol) Triethylamin getropft und das Ganze 15 Minuten nachgerührt. Anschließend gab man 6,8 g (0,05 mol) iso-Butylchlorkohlsäureester zu und beließ 10 Minuten bei -15°C. Zu dieser Lösung wurden 7,8 g (0,05 mol) N-Methyl-N-(4-chlorphenyl)-hydrazin in 50 ml Dimethylformamid gegeben. Es wurde 1 Stunde bei -15°C nachgerührt und die Reaktionsmischung weitere 2 Stunden bei 20°C belassen. Anschließend wurde das Lösungsmittel abdestilliert, der Rückstand in Essigsäureethylester aufgenommen und die organische Phase nacheinander mit je-

## 40

weils 10 ml 5 gew.-%iger Zitronensäure, 5 gew.-%iger Natriumhydrogencarbonat-Lösung und Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde getrocknet, eingeengt und der verbleibende Rückstand an Kieselgel chromatographiert (Methyl-tert.-butylether:n-Hexan = 5 1:1). Man erhielt 5,5 g der Titelverbindung als orange-rotes Harz (Verbindung 27 in Tabelle 6).

## Beispiel 4

**10** N<sup>α</sup>-(tert.-Butyloxycarbonyl)-L-valin-[2-methyl-2-(4-methylphenyl)]-hydrazid

Zu der Lösung von 10,85 g (0,05 mol) N-tert.-Butyloxycarbonyl-L-valin und 5,95 g (0,05 mol) 4-Methylphenylhydrazin in 100 ml  
**15** Tetrahydrofuran wurden 5,1 g (0,051 mol) Triethylamin und danach bei 0°C 8,31 g (0,051 mol) Cyanphosphonsäurediethylester gegeben. Es wurde eine Stunde bei 0°C und weitere 15 Stunden bei 20°C gerührt, und nach Entfernen des Lösungsmittel wurde der Rückstand  
**20** mit jeweils 40 ml 10 gew.-%iger Natriumhydroxid-Lösung, 10 gew.-%iger Salzsäure, gesättigter Natriumhydrogencarbonat-Lösung und Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde getrocknet und danach das Lösungsmittel entfernt. Es verblieben 9,8 g N<sup>α</sup>-(tert.-Butyloxycarbonyl)-L-valin-[2-(4-methylphenyl)]-hydrazid (Fp.:  
**25** 163-164°C, Verbindung 21 in Tabelle 6).

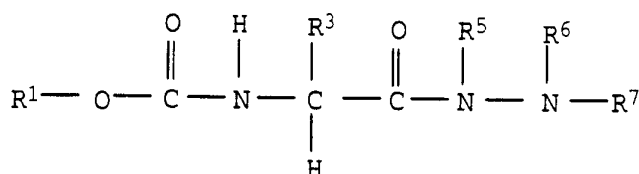
Zu 1 g (3,1 mmol) dieser Verbindung in 10 ml Dimethylformamid wurden bei 20°C 0,48 g (3,4 mmol) Methyljodid und 0,47 g (3,4 mmol) Kaliumcarbonat gegeben. Man beließ bei dieser Temperatur  
**30** bis keine Ausgangsverbindung mehr nachweisbar war und destillierte anschließend das Lösungsmittel ab. Der Rückstand wurde in Essigsäureethylester aufgenommen. Die organische Phase wurde mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeengt. Das verbliebene Öl wurde an Kieselgel chromatographiert (Cyclohexan:Essigsäureethyl-  
**35** ester = 2:1) und man erhielt 0,3 g der Titelverbindung als gelbes Öl (Verbindung 28 in Tabelle 6).

40

45

Tabelle 8

5



10

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Fp (°C) / IR (cm <sup>-1</sup> )	
1	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	108	
15	2	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	115
3	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	138-140	
4	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	118-120	
5	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	154	
20	6	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1)
7	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	Öl	
8	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	163	
9	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	154	
10	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	178-180	
25	11	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	161
12	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	84-86	
13	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	137-139	
14	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	118-120	
30	15	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	156
16	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	163-165	
17	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	168	
18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	118-120	
35	19	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	124-126
20	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	162	
21	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	163-164	
22	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	133	
23	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	171	
40	24	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	171
25	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	184-185	
26	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	189-193	
27	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	2)	
45	28	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	3)
29	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	130	

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Fp (°C) / IR (cm <sup>-1</sup> )	
5	30	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	137-139
	31	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	141-142
	32	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	160-161
	33	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	164-166
	34	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	168-172
10	35	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	171-173
	36	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	161-171
	37	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	221-223
	38	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	193-194
	39	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	166-168
15	40	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	152
	41	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	162
	42	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	136
	43	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	193-195
	44	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	176-177
20	45	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	142
	46	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	139
	47	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	188
	48	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	160
	49	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	146-148
25	50	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	216
	51	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	Öl
	52	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	130-132
	53	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	172-175
	54	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	158-160
30	55	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	161
	56	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	128-130
	57	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	160
	58	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	139
	59	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	Öl
35	60	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	173-175

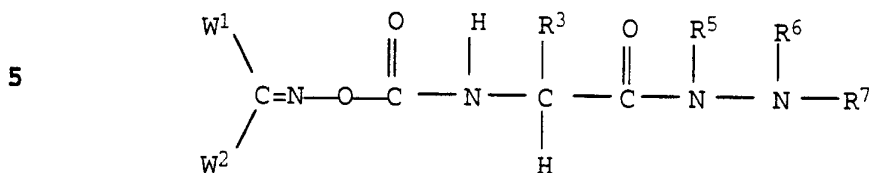
40

1) IR (cm<sup>-1</sup>): 3280, 2969, 2935, 1674, 1515, 12432) 1H-NMR (CDCl<sub>3</sub>): 0,98 (dd,2H); 1,4 (s,9H); 2,12 (m,1H); 3,8 (s,3H); 3,95 (t,1H); 5,35 (d,1H,NH); 6,8 (d,2H); 7,18 (d,2H)3) 1H-NMR (CDCl<sub>3</sub>): 1,98 (dd,6H); 1,45 (s,9H); 2,13 (m,1H); 2,25 (s,3H); 3,12 (s,3H); 3,87 (t,1H); 5,2 (d,1H,NH); 6,74 (d,2H);

45

7,00 (d,2H); 8,13 (s,1H,NH)

Tabelle 9



10

Nr.	W <sup>1</sup>	W <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Fp. (°C)
1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	104
2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	84

15 Anwendungsbeispiele

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I ließ sich durch folgende Versuche zeigen:

- 20 Die Wirkstoffe wurden als 20 gew.-%ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanol, 20 Gew.-% Nekanil<sup>®</sup> LN (Lutensol<sup>®</sup> AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Emulphor<sup>®</sup> EL (Emulan<sup>®</sup> EL, Emulgator auf der Basis ethoxylierter Fettalkohole) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Plasmopara viticola

- 30 Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit wäßriger Spritzbrühe, die 80 Gew.-% Wirkstoff und 20 Gew.-% Emulgiermittel in der Trockensubstanz enthielt, besprüht. Um die Wirkungdauer der Wirkstoffe beurteilen zu können, wurden die Pflanzen nach dem Antrocknen des Spritzbelages 8 Tage im Gewächshaus aufgestellt. Erst dann wurden die Blätter mit einer Zoosporenaufschwemmung von Plasmopara viticola (Rebenperonospora) infiziert. Die Reben wurden zunächst für 48 Stunden in einer Kammer mit wasserdampfgesättigter Luft bei 24°C und anschließend für 5 Tage in einem Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in der feuchten Kammer aufgestellt. Dann erfolgte die visuelle Beurteilung des Ausmaßes des Pilzausbruchs auf den Blattunterseiten.
- 45 In diesem Test zeigten jeweils die mit einer 250 ppm enthaltenden wäßrigen Aufbereitung der Verbindungen 4, 6, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20 bzw. 22 aus Tabelle 6 behandelten Pflanzen

einen maximalen Befall von 15 %, während unbehandelte Pflanzen zu 70 % befallen waren.

5

10

15

20

25

30

35

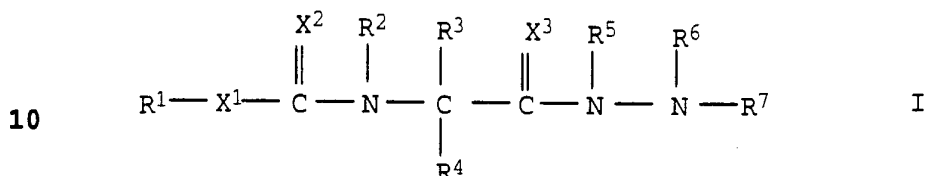
40

45

## Patentansprüche

1. Carbamoylcarbonsäurehydrazide der allgemeinen Formel I

5



10

sowie deren Salze, in denen die Reste die folgende Bedeutung haben:

15

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl,

20

25

C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl, Aryloxy und Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die cyclischen Gruppen einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy,

30

35

40

einen nicht-aromatischen 4- bis 8-gliedrigen Ring, welcher als Ringglieder neben Kohlenstoff noch eines oder zwei der Heteroatome Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann, wobei die Kohlenstoffatome im Ring eine oder zwei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio,

45

## 46

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy und wobei das zweite und jedes weitere Stickstoffatom als Heteroatom im Ring Wasserstoff oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylgruppe trägt,

- 5 Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, in
- 10 denen die cyclischen Substituenten ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl oder
- 15 W<sup>1</sup>W<sup>2</sup>C=N-, wobei
- 20 W<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl bedeutet, welches partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten
- 25 tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy,
- 30 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy, wobei
- 35 die cyclischen Gruppen ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy,
- 40 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und
- 45 Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die Gruppen, welche Aryl enthalten, einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy oder

- 5 Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy und
- 10 W<sup>2</sup> Wasserstoff oder eine der Gruppen W<sup>1</sup>;
- R<sup>2</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, welche partiell oder vollständig halogeniert sein können;
- 15 R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, wobei dieser Rest eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl,
- 20 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Phenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die Ringe dieser Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und
- 25 Aryloxy;
- R<sup>4</sup> Wasserstoff oder einen der Reste R<sup>3</sup> oder
- 30 R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> gemeinsam mit dem C-Atom, an das sie gebunden sind, einen 4- bis 8-gliedrigen Ring, welcher als Ring-glieder neben Kohlenstoff noch ein oder zwei der Hetero-atome Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann, wobei die Kohlenstoffatome im Ring eine oder zwei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano,
- 35 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl und Aryloxy und wobei Stickstoff als Heteroatom Wasserstoff oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-gruppe trägt;
- 40 R<sup>5</sup> einen der Reste R<sup>2</sup>;
- 45 R<sup>6</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, Aryl, Aryloxy und

- 5 Heteroaryl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl,
- 10 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkenyl, wobei diese Reste partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, wobei die cyclischen Gruppen einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl und Aryloxy,
- 15 einen nicht-aromatischen 4- bis 8-gliedrigen Ring, welcher als Ringglieder neben Kohlenstoff noch eines oder zwei der Heteroatome Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann, wobei die Kohlenstoffatome im Ring eine oder zwei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl und Aryloxy und wobei das zweite und jedes weitere Stickstoffatom als Heteroatom im Ring Wasserstoff oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylgruppe trägt,
- 20 Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Reste eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, in denen die cyclischen Substituenten ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder
- 25 wenn R<sup>3</sup> für iso-Propyl steht, Wasserstoff;
- 30 R<sup>7</sup> einen der Reste R<sup>6</sup>, ausgenommen Wasserstoff;
- 35 X<sup>1</sup> Sauerstoff oder Schwefel,  
X<sup>2</sup> Sauerstoff oder Schwefel,  
45 X<sup>3</sup> Sauerstoff oder Schwefel;

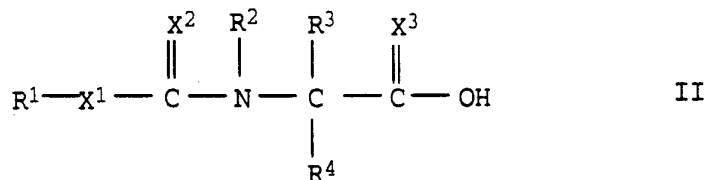
ausgenommen die Verbindungen gemäß folgender Definition der Reste:

- 5 Ia-d (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  
CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> =  
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl),
- Ie-h (R<sup>1</sup> = C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,  
CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H;  
R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br),
- 10 Ii (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH<sub>3</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H;  
R<sup>6</sup> = CH<sub>3</sub>; R<sup>7</sup> = Ph),
- Ij-k (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder  
CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = Ph),
- 15 Il (R<sup>1</sup> = C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;  
R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> = H; R<sup>7</sup> = Ph),
- Im (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H;  
R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>),
- In-o (R<sup>1</sup> = Ph-CH<sub>2</sub>; R<sup>2</sup> = H; R<sup>3</sup> = CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> oder  
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>; R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> = H; R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl).

20

2. Verfahren zur Herstellung von Carbamoylcarbonsäurehydraziden der allgemeinen Formel I oder deren Salzen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Carbamoylcarbonsäure der allgemeinen Formel II

25



30

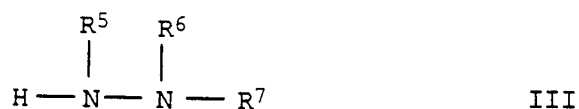
mit einem Hydrazin der allgemeinen Formel III

35

40

45

50

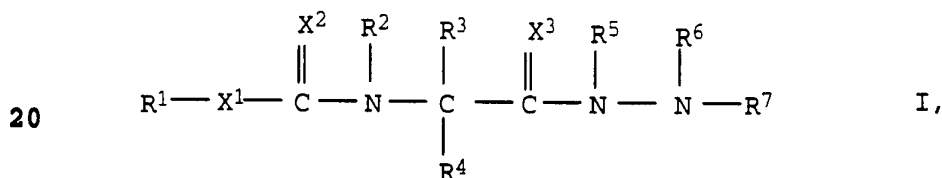


5

umsetzt und die so erhaltene Verbindung I gewünschtenfalls in an sich bekannter Weise in eines ihrer Salze überführt.

- 10 3. Verfahren zur Herstellung von Carbamoylcarbonsäurehydraziden der allgemeinen Formel I, in denen R<sup>1</sup> für eine Gruppe W<sup>1</sup>W<sup>2</sup>C=N- steht, oder deren Salzen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbamoylcarbonsäurehydrazid der allgemeinen Formel I

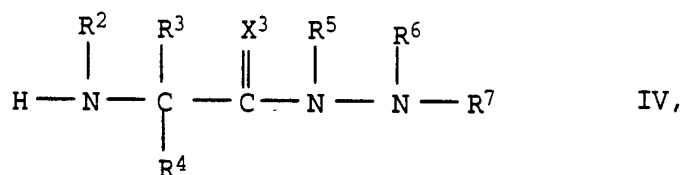
15



20

25 in der X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup> und X<sup>3</sup> jeweils Sauerstoff bedeuten und die Gruppe R<sup>1</sup>-X<sup>1</sup>-(CO) für eine Schutzgruppe steht, die in an sich bekannter Weise abgespalten werden kann, in ein Aminosäurehydrazid IV

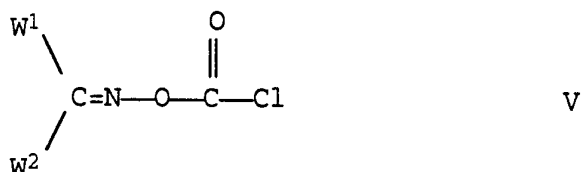
30



35

überführt, das so erhaltene Aminosäurehydrazid IV mit einem Chlorformyloxim der allgemeinen Formel V

40



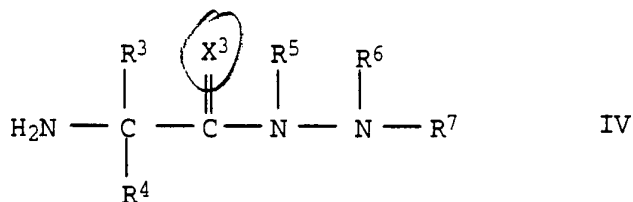
45

## 51

in Gegenwart einer Base umgesetzt und die so erhaltene Verbindung I gewünschtenfalls in an sich bekannter Weise in eines ihrer Salze überführt.

- 5 4. Verfahren zur Herstellung von Carbamoylcarbonsäurehydraziden der allgemeinen Formel I oder deren Salzen gemäß Anspruch 1, in der R<sup>6</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl steht, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbamoylcarbonsäurehydrazid der allgemeinen Formel I gemäß
- 10 Anspruch 1, in der R<sup>6</sup> Wasserstoff bedeutet, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel R<sup>6</sup>-X, in welcher R<sup>6</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl steht und X eine negative Abgangsgruppe bedeutet, unter Mit-
- 15 verwendung einer Base umgesetzt und die so erhaltene Verbindung I gewünschtenfalls in an sich bekannter Weise in eines ihrer Salze überführt.
5. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignete Mittel, enthaltend übliche Zusatzstoffe und eine wirksame Menge einer Verbindung
- 20 der allgemeinen Formel I oder eines ihrer Salze gemäß Anspruch 1, ausgenommen die Verbindungen Ia bis Io .
6. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Schadpilze, deren Lebensraum oder die
- 25 von ihnen freizuhaltenden Pflanzen, Flächen, Materialien oder Räume mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I oder eines ihrer Salze gemäß Anspruch 1, einschließlich der Verbindungen Ia bis Io, oder einem I enthaltenden Mittel gemäß Anspruch 5 behandelt.
- 30 7. Verwendung der Verbindungen der allgemeinen Formel I oder eines ihrer Salze gemäß Anspruch 1, einschließlich der Verbindungen Ia bis Io, zur Bekämpfung von Schadpilzen.
- 35 8. Aminosäurehydrazide der allgemeinen Formel IV

40



45

in der  $X^3$  für Sauerstoff und  $R^3$  für eine Gruppe  $CH(CH_3)_2$ ,  $CH_2CH(CH_3)_2$  oder  $CH(CH_3)C_2H_5$  steht und  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  und  $R^7$  die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, ausgenommen die Verbindungen gemäß folgender Definition der Reste:

- 5  
 IVa-b ( $R^3 = CH(CH_3)_2$  oder  $(CH_2)_2CH_3$ ;  $R^4, R^5 = H$ ;  $R^6, R^7 = CH_2CH_2Cl$ ),  
 IVC-e ( $R^3 = CH(CH_3)_2$ ,  $CH(CH_3)CH_2CH_3$  oder  $CH_2CH(CH_3)_2$ ;  $R^4, R^5 = H$ ;  $R^6, R^7 = CH_2CH_2Br$ ),  
 10 IVf ( $R^3 = CH(CH_3)_2$ ;  $R^4, R^5, R^6 = H$ ;  $R^7 = Ph$ ),  
 IVg ( $R^3 = CH(CH_3)_2$ ;  $R^4, R^5 = H$ ;  $R^6, R^7 = Ph$ ).
9. Aminosäurehydrazide der allgemeinen Formel IV nach Anspruch 8, in der  $R^3$  für eine Gruppe  $CH(CH_3)_2$  steht,  $R^4$  und  
 15  $R^5$  die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,  
 $R^6$  für  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl steht, wobei dieser Rest partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei der  
 20 folgenden Gruppen tragen kann: Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_3$ - $C_7$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_7$ -Cycloalkenyl, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano,  
 25  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxyalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl und  
 $R^7$  für Aryl steht, wobei dieser Rest eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  
 30  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxyalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio, Aryl, Aryloxy und Heteroaryl, in denen die cyclischen Substituenten ihrerseits einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxyalkyl,  
 35  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy und  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio.

40

45

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International Application No  
PCT/EP 95/01924

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> IPC 6 C07C271/22 C07C271/54 C07C271/34 C07C333/04 C07C271/60 C07C333/20 C07C243/38 A01N47/12 A01N47/14 A01N47/18 A01N47/22 A01N47/24							
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC							
<b>B. FIELDS SEARCHED</b> Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 6 C07C							
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)							
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>							
Category <sup>o</sup>	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages				Relevant to claim No.		
X	PHARMAZIE, vol.44, no.8, 1989, BERLIN DD pages 542 - 544 S. ZAKHARIEV ET AL. 'Synthese und geschwulsthemmende Wirkung von N,N-Di(2-chlorethyl)-hydrazinen der .alpha.-Aminocarbonsäureantimetabolite' see page 543, examples 1,3,5 ---				1,2		
X	PHARMAZIE, vol.44, no.9, 1989, BERLIN DD pages 608 - 611 S. ZAKHARIEV ET AL. 'Synthese und geschwulsthemmende Wirkung in vivo von N,N,-Di(2-chloroethyl)hydraziden natürlicher .alpha.Aminocarbonsäuren' cited in the application see page 610, example 46 --- -/--				1,2		
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.							
<sup>o</sup> Special categories of cited documents : <table border="0" style="width:100%"> <tr> <td style="width:50%">                     "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                 </td> <td style="width:50%">                     "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.                      "&amp;" document member of the same patent family                 </td> </tr> </table>						"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
"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  <p align="center">30 October 1995</p>			Date of mailing of the international search report  <p align="center">07.11.95</p>				
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  <p align="center">Seufert, G</p>				

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern: al Application No  
PCT/EP 95/01924

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>PHARMAZIE, vol.44, no.5, 1989, BERLIN DD pages 316 - 317 S. ZAKHARIEV ET AL. 'Synthese von N,N-Di(2-brometyl)hydraziden einiger natürlicher .alpha.-Aminocarbonsäuren' cited in the application see page 316, example 7</p> <p style="text-align: center;">---</p>	1,2
X	<p>JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol.25, no.11, 1982, WASHINGTON US pages 1317 - 1321 E. ESCHER ET AL. 'Structure-activity studies on the C-terminal amide of substance P' see page 1319, right column, line 20 - line 33</p> <p style="text-align: center;">---</p>	1
X	<p>CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN., vol.29, no.12, 1981, TOKYO JP pages 3630 - 3638 S. SHINAGAWA ET AL. 'Synthetic studies on enkephalin analogs. I. Potent analgesic activity of H-Tyr-D-Ala-Gly-Phe-NHNH-CO-R (R= lower alkyl)' see table I, examples 19, 11</p> <p style="text-align: center;">---</p>	1
X	<p>CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 94, no. 9, 2 March 1981, Columbus, Ohio, US; abstract no. 58093, S. ZAKHARIEV ET AL. page 40 ; siehe RN 75016-97-6, L-Phenylalanine, N-[(phenylmethoxy)carbonyl]-, 2,2-bis(2- iodoethyl)hydrazide siehe RN 75027-32-6, DL-Phenylalanine, 4-chloro-N-[(phenylmethoxy)carbonyl]-, 2,2-bis(2-chloroethyl)hydrazide &amp; NEOPLASMA, vol.27, no.2, 1980 pages 137 - 142</p> <p style="text-align: center;">---</p>	1
X	<p>CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 77, no. 13, 25 September 1972, Columbus, Ohio, US; abstract no. 88819, K. RADECKI ET AL. page 496 ; cited in the application siehe RN 37637-46-0, L-Glutamic acid, N-[(phenylmethoxy)carbonyl]-, 5-ethyl ester, 1-(2,2-diphenylhydrazide) &amp; FARM. POL., vol.28, no.6, 1972 pages 615 - 619</p> <p style="text-align: center;">---</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	1

1

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern: al Application No  
PCT/EP 95/01924

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

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 65, no. 5, 29 August 1966, Columbus, Ohio, US; abstract no. 7269h, BOZENNA BATOR ET AL siehe RN 6715-75-9, Valine, N-carboxy-, N-benzyl ester, 2-phenylhydrazide, L- & ROCZNIKI CHEM., vol.40, no.5, 1966 pages 761 - 766 -----	1
A	DE,B,11 99 540 (SCHERING AG) 26 August 1965 cited in the application see claim; examples -----	1,5-7

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 95/01924

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE-B-1199540		CH-A- 450058 FR-A- 1418676 NL-A- 6501398 US-A- 3214334	11-02-66 05-08-66 26-10-65
-----			

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 95/01924

**A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**

IPK 6 C07C271/22 C07C271/54 C07C271/34 C07C333/04 C07C271/60  
 C07C333/20 C07C243/38 A01N47/12 A01N47/14 A01N47/18  
 A01N47/22 A01N47/24

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

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
 IPK 6 C07C

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

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

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	PHARMAZIE, Bd.44, Nr.8, 1989, BERLIN DD Seiten 542 - 544 S. ZAKHARIEV ET AL. 'Synthese und geschwulsthemmende Wirkung von N,N-Di(2-chlorethyl)-hydrazinen der .alpha.-Aminocarbonsäureantimetabolite' siehe Seite 543, Beispiele 1,3,5 ---	1,2
X	PHARMAZIE, Bd.44, Nr.9, 1989, BERLIN DD Seiten 608 - 611 S. ZAKHARIEV ET AL. 'Synthese und geschwulsthemmende Wirkung in vivo von N,N,-Di(2-chloroethyl)hydraziden natürlicher .alpha.Aminocarbonsäuren' in der Anmeldung erwähnt siehe Seite 610, Beispiel 46 ---	1,2

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

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

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

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

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

30. Oktober 1995

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

07.11.95

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

Bevollmächtigter Bediensteter

Seufert, G

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	PHARMAZIE, Bd.44, Nr.5, 1989, BERLIN DD Seiten 316 - 317 S. ZAKHARIEV ET AL. 'Synthese von N,N-Di(2-bromethyl)hydraziden einiger natürlicher .alpha.-Aminocarbonsäuren' in der Anmeldung erwähnt siehe Seite 316, Beispiel 7 ---	1,2
X	JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, Bd.25, Nr.11, 1982, WASHINGTON US Seiten 1317 - 1321 E. ESCHER ET AL. 'Structure-activity studies on the C-terminal amide of substance P' siehe Seite 1319, rechte Spalte, Zeile 20 - Zeile 33 ---	1
X	CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN., Bd.29, Nr.12, 1981, TOKYO JP Seiten 3630 - 3638 S. SHINAGAWA ET AL. 'Synthetic studies on enkephalin analogs. I. Potent analgesic activity of H-Tyr-D-Ala-Gly-Phe-NHNH-CO-R (R= lower alkyl)' siehe Tabelle I, Beispiele 19, 11 ---	1
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 94, no. 9, 2. März 1981, Columbus, Ohio, US; abstract no. 58093, S. ZAKHARIEV ET AL. Seite 40 ; siehe RN 75016-97-6, L-Phenylalanine, N-[(phenylmethoxy)carbonyl]-, 2,2-bis(2- iodoethyl)hydrazide siehe RN 75027-32-6, DL-Phenylalanine, 4-chloro-N-[(phenylmethoxy)carbonyl]-, 2,2-bis(2-chloroethyl)hydrazide & NEOPLASMA, Bd.27, Nr.2, 1980 Seiten 137 - 142 ---	1
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 77, no. 13, 25. September 1972, Columbus, Ohio, US; abstract no. 88819, K. RADECKI ET AL. Seite 496 ; in der Anmeldung erwähnt siehe RN 37637-46-0, L-Glutamic acid, N-[(phenylmethoxy)carbonyl]-, 5-ethyl ester, 1-(2,2-diphenylhydrazide) & FARM. POL., Bd.28, Nr.6, 1972 Seiten 615 - 619 --- ---	1

1

-/--

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 65, no. 5, 29. August 1966, Columbus, Ohio, US; abstract no. 7269h, BOZENNA BATOR ET AL siehe RN 6715-75-9, Valine, N-carboxy-, N-benzyl ester, 2-phenylhydrazide, L- & ROCZNIKI CHEM., Bd.40, Nr.5, 1966 Seiten 761 - 766	1
A	<p style="text-align: center;">---</p> DE,B,11 99 540 (SCHERING AG) 26. August 1965 in der Anmeldung erwähnt siehe Anspruch; Beispiele <p style="text-align: center;">-----</p>	1,5-7

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 95/01924

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
DE-B-1199540		CH-A- 450058 FR-A- 1418676 NL-A- 6501398 US-A- 3214334	11-02-66 05-08-66 26-10-65
-----			