



(11) **EP 2 953 942 B1**

(12) **EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT**

(45) Veröffentlichungstag und Bekanntmachung des Hinweises auf die Patenterteilung:  
**25.10.2017 Patentblatt 2017/43**

(51) Int Cl.:  
**C07D 403/04** (2006.01) **A01N 43/56** (2006.01)  
**C07D 401/12** (2006.01)

(21) Anmeldenummer: **14702570.4**

(86) Internationale Anmeldenummer:  
**PCT/EP2014/051989**

(22) Anmeldetag: **03.02.2014**

(87) Internationale Veröffentlichungsnummer:  
**WO 2014/122083 (14.08.2014 Gazette 2014/33)**

(54) **HALOGENSUBSTITUIERTE PYRAZOLDERIVATE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL**

HALOGEN-SUBSTITUTED PYRAZOLE DERIVATIVES AS PESTICIDES

DÉRIVÉS DE PYRAZOLE SUBSTITUÉS PAR DES HALOGÈNES COMME DES AGENTS PESTICIDES

(84) Benannte Vertragsstaaten:  
**AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO RS SE SI SK SM TR**

(30) Priorität: **06.02.2013 EP 13154269**  
**12.08.2013 EP 13180076**

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
**16.12.2015 Patentblatt 2015/51**

(73) Patentinhaber: **Bayer CropScience Aktiengesellschaft**  
**40789 Monheim (DE)**

(72) Erfinder:  
• **MAUE, Michael**  
**40764 Langenfeld (DE)**  
• **ILG, Kerstin**  
**50670 Köln (DE)**  
• **DÉCOR, Anne**  
**40764 Langenfeld (DE)**  
• **BRETSCHNEIDER, Thomas**  
**deceased (DE)**  
• **HAHN, Julia, Johanna**  
**40597 Düsseldorf (DE)**

- **HALLENBACH, Werner**  
**40789 Monheim (DE)**
- **FISCHER, Reiner**  
**40789 Monheim (DE)**
- **SCHWARZ, Hans-Georg**  
**46282 Dorsten (DE)**
- **GÖRGENS, Ulrich**  
**40882 Ratingen (DE)**
- **RAMING, Klaus**  
**51375 Leverkusen (DE)**
- **KÖBBERLING, Johannes**  
**41466 Neuss (DE)**
- **HÜBSCH, Walter**  
**42113 Wuppertal (DE)**
- **TURBERG, Andreas**  
**42781 Haan (DE)**
- **LINDNER, Niels**  
**42115 Wuppertal (DE)**

(74) Vertreter: **BIP Patents**  
**c/o Bayer Intellectual Property GmbH**  
**Alfred-Nobel-Straße 10**  
**40789 Monheim am Rhein (DE)**

(56) Entgegenhaltungen:  
**WO-A1-2012/080376 WO-A1-2012/107434**

**EP 2 953 942 B1**

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents im Europäischen Patentblatt kann jedermann nach Maßgabe der Ausführungsordnung beim Europäischen Patentamt gegen dieses Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist. (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).

## Beschreibung

**[0001]** Die vorliegende Anmeldung betrifft neue Halogen-substituierte Verbindungen, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, vor allem von Arthropoden und insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Nematoden.

**[0002]** Es ist bekannt, dass bestimmte Halogen-substituierte Verbindungen herbizid wirksam sind (vgl. J. Org. Chem. 1997, 62(17), 5908-5919, J. Heterocycl. Chem. 1998, 35(6), 1493-1499, WO 2004/035545, WO 2004/106324, US 2006/069132, WO 2008/029084).

**[0003]** Des Weiteren ist bekannt, daß bestimmte Halogen-substituierte Verbindungen insektizid wirksam sind (EP 1 911 751, WO2012/069366, WO2012/080376 & WO2012/107434).

**[0004]** Ferner ist bekannt, dass bestimmte Halogen-substituierte Verbindungen Cytokin-inhibitorische Aktivitäten aufweisen (WO 2000/07980).

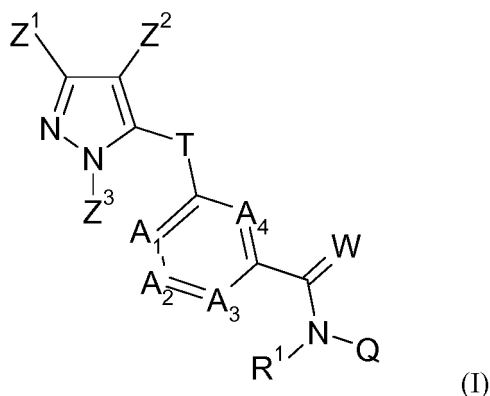
**[0005]** Moderne Pflanzenschutzmittel müssen vielen Anforderungen genügen, beispielsweise in Bezug auf Höhe, Dauer und Breite ihrer Wirkung und möglichen Verwendung. Es spielen Fragen der Toxizität, der Kombinierbarkeit mit anderen Wirkstoffen oder Formulierungshilfsmitteln eine Rolle sowie die Frage des Aufwands, der für die Synthese eines Wirkstoffs betrieben werden muss. Ferner können Resistenzen auftreten. Aus all diesen Gründen kann die Suche nach neuen Pflanzenschutzmitteln nie als abgeschlossen betrachtet werden und es besteht ständig Bedarf an neuen Verbindungen mit gegenüber den bekannten Verbindungen zumindest in Bezug auf einzelne Aspekte verbesserten Eigenschaften.

**[0006]** Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, Verbindungen bereitzustellen, durch die das Spektrum der Schädlingsbekämpfungsmittel unter verschiedenen Aspekten verbreitert und/oder ihre Aktivität verbessert wird.

**[0007]** Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass bestimmte Halogen-substituierte Verbindungen, sowie deren *N*-Oxide und Salze biologische Eigenschaften aufweisen und sich insbesondere zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen eignen, und deshalb besonders gut im agrochemischen Bereich und im Bereich der Tiergesundheit einsetzbar sind.

**[0008]** Ähnliche Verbindungen sind bereits aus WO 2010/051926 bekannt geworden.

**[0009]** Die erfindungsgemäßen Halogen-substituierten Verbindungen sind durch die allgemeine Formel (I)



definiert, in denen

**R<sup>1</sup>** für Wasserstoff, gegebenenfalls ein- oder mehrfach unabhängig voneinander mit Halogen, Cyano, Alkoxy und Alkoxy-carbonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, Heteroaryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl,

die chemischen Gruppierungen

**A<sub>1</sub>** für CR<sup>2</sup> oder Stickstoff,

**A<sub>2</sub>** für CR<sup>3</sup> oder Stickstoff,

**A<sub>3</sub>** für CR<sup>4</sup> oder Stickstoff, und

**A<sub>4</sub>** für CR<sup>5</sup> oder Stickstoff stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A<sub>1</sub> bis A<sub>4</sub> gleichzeitig für Stickstoff stehen;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-imino-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino oder N,N-Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino stehen;

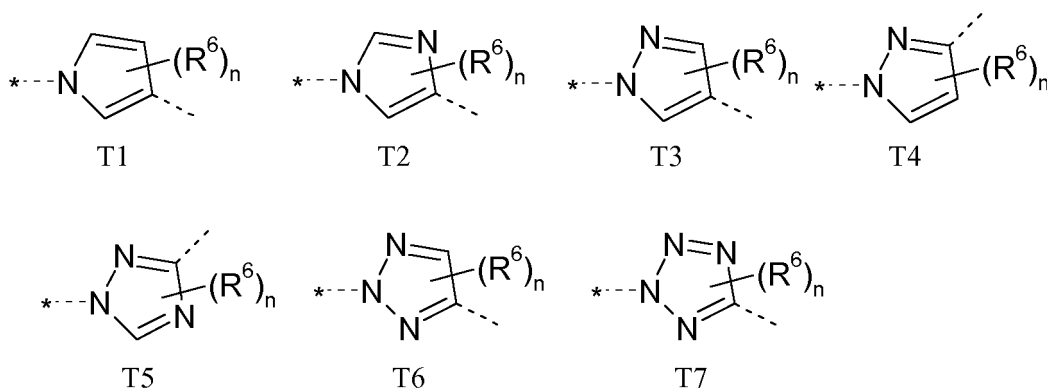
W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

Q für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl oder eine der gegebenenfalls unabhängig von einander ein- oder mehrfach mit Hydroxy, Nitro, Amino, Halogen, Alkoxy, Cyano, Hydroxycarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbamoyl, Cycloalkylcarbamoyl, Phenyl substituierten Gruppierungen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-Heterocycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, Aryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, Heteroaryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonylamino oder N,N-Di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino steht; oder

Q für ein mit 0 - 4 Substituenten V substituierten Aryl oder für ein mit 0 - 4 Substituenten V substituierten 5 bzw. 6 gliedrigen Heteroaromaten steht, wobei

V unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-imino-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, N,N-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino steht;

T für einen der nachfolgend aufgeführten 5 gliedrigen Heteroaromaten T1-T7 steht, wobei die Bindung zur Pyrazolkopfgruppe mit einem Sternchen gekennzeichnet ist,



wobei

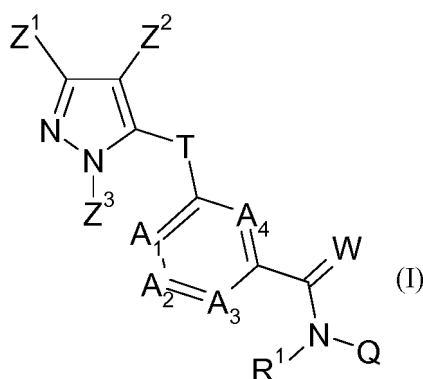
R<sup>6</sup> unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Nitro, Amino oder ein gegebenfalls einfach bis mehrfach mit Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, und n für die Werte 0-1 stehen;

Z<sup>1</sup> für ein gegebenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-cyclo-alkyl, und

Z<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Amino oder ein gegebenfalls einfach oder mehrfach substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, und

Z<sup>3</sup> für Wasserstoff oder ein gegebenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, Aryl und Hetaryl stehen;

**[0010]** Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I)



5

10

15 definiert, in denen

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls ein- bis fünffach unabhängig voneinander mit Halogen, Cyano, Alkoxy und Alkoxy-carbonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, Heteroaryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl,

20

die chemischen Gruppierungen

A<sub>1</sub> für CR<sup>2</sup> oder Stickstoff,

25

A<sub>2</sub> für CR<sup>3</sup> oder Stickstoff,

A<sub>3</sub> für CR<sup>4</sup> oder Stickstoff, und

A<sub>4</sub> für CR<sup>5</sup> oder Stickstoff stehen,

30

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A<sub>1</sub> bis A<sub>4</sub> gleichzeitig für Stickstoff stehen;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls unabhängig von einander ein- bis fünffach mit Hydroxy, Nitro, Amino, Halogen, Alkoxy, Cyano, Hydroxycarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbamoyl, Cycloalkylcarbamoyl, Phenyl substituierten C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-imino-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino oder N,N-Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino stehen;

35

W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

40

Q für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl oder eine der gegebenenfalls unabhängig von einander ein- bis fünffach mit Hydroxy, Nitro, Amino, Halogen, Alkoxy, Cyano, Hydroxycarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbamoyl, Cycloalkylcarbamoyl, Phenyl substituierten Gruppierungen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-Heterocycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, Aryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, Heteroaryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonylamino oder N,N-Di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino steht; oder

45

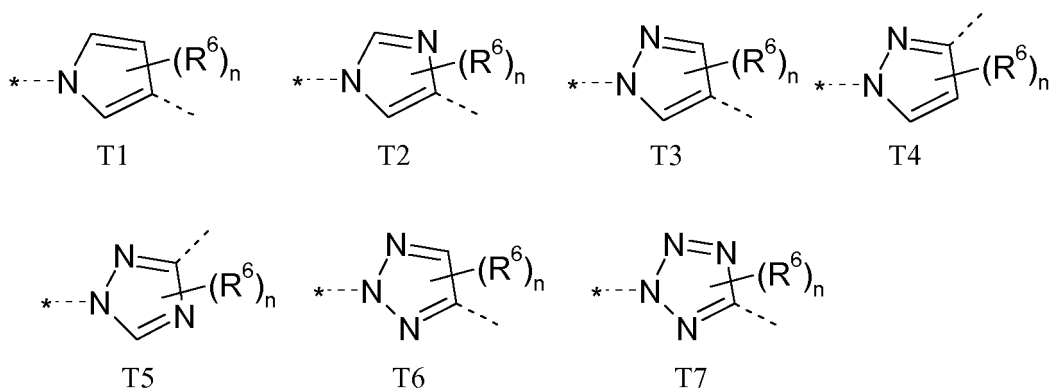
Q für ein mit 0 - 4 Substituenten V substituierten Aryl oder für ein mit 0 - 4 Substituenten V substituierten 5 bzw. 6 gliedrigen Heteroaromaten steht, wobei

V unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls unabhängig von einander einbis fünffach mit Hydroxy, Nitro, Amino, Halogen, Alkoxy, Cyano, Hydroxycarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbamoyl, Cycloalkylcarbamoyl, Phenyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-imino-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-sulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, N,N-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino steht;

50

T für einen der nachfolgend aufgeführten 5 gliedrigen Heteroaromaten T1-T7 steht, wobei die Bindung zur Pyrazolkopfgruppe mit einem Sternchen gekennzeichnet ist,

55



wobei

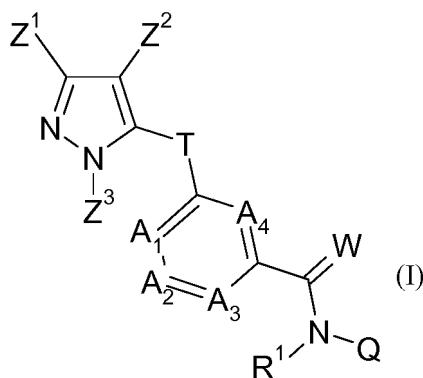
$R^6$  unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Nitro, Amino oder ein gegebenenfalls einfach bis fünffach mit Halogen substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyloxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfanyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl, und  $n$  für die Werte 0-1 stehen;

$Z^1$  für ein gegebenenfalls ein- bis fünffach mit Hydroxy, Nitro, Amino, Halogen, Alkoxy, Cyano, Hydroxycarbonyl, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbamoyl, Cycloalkylcarbamoyl, Phenyl substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogen cycloalkyl, und

$Z^2$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Amino oder ein gegebenenfalls unabhängig von einander ein- bis fünffach mit Hydroxy, Nitro, Amino, Halogen, Alkoxy, Cyano, Hydroxycarbonyl, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbamoyl, Cycloalkylcarbamoyl, Phenyl substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfanyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl, und

$Z^3$  für Wasserstoff oder ein gegebenenfalls unabhängig von einander ein- bis fünffach mit Hydroxy, Nitro, Amino, Alkoxy, Cyano, Hydroxycarbonyl, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbamoyl, Cycloalkylcarbamoyl, Phenyl substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkenyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkynyl, Aryl und Hetaryl stehen;

**[0011]** Speziell bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I)



definiert, in denen

50  $R^1$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl, t-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, s-Butylcarbonyl, t-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, s-Butoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Benzyl, 4-Methoxybenzyl, Pyrid-2-yl-methyl, Pyrid-3-yl-methyl, Pyrid-4-yl-methyl, 4-Chlor-pyrid-3-yl-methyl steht;

55 die chemischen Gruppierungen

$A_1$  für  $CR^2$  oder Stickstoff,

A<sub>2</sub> für CR<sup>3</sup> oder Stickstoff,

A<sub>3</sub> für CR<sup>4</sup> oder Stickstoff, und

5 A<sub>4</sub> für CR<sup>5</sup> oder Stickstoff stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A<sub>1</sub> bis A<sub>4</sub> gleichzeitig für Stickstoff stehen;

10 R<sup>2</sup> und R<sup>5</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Fluor und Chlor stehen und

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Chlordifluormethyl, Trifluormethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, N-Methoxyiminomethyl, 1-(N-Methoxyimino)-ethyl, Methylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl stehen

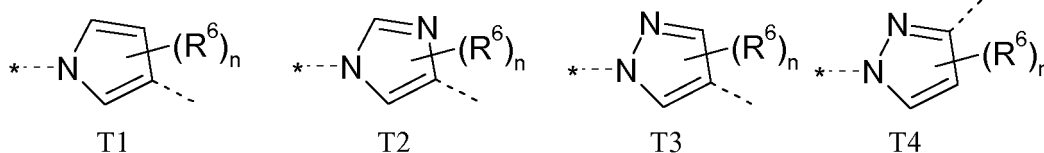
W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

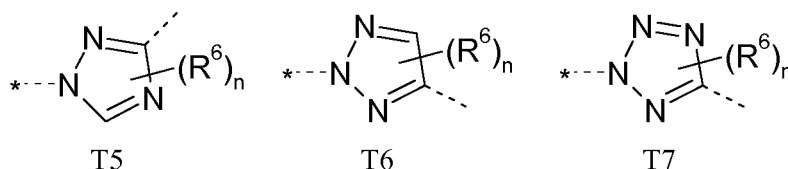
20 Q für für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, 1,1-Dimethylethyl, 1-Methylpropyl, n-Butyl, 2-Methylpropyl, 2-Methylbutyl, Hydroxyethyl, 2-Hydroxypropyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-Trifluormethylethyl, 2,2-Difluorpropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 2,2-Dimethyl-3-fluorpropyl, Cyclopropyl, 1-Cyano-cyclopropyl, 1-Methoxycarbonyl-cyclopropyl, 1-(N-Methylcarbamoyl)cyclopropyl, 1-carbamoylcyclopropyl, 1-Carbamothioyl-cyclopropyl, 1-(N-Cyclopropylcarbamoyl)cyclopropyl, Cyclopropyl-methyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, 1-Cyclopropylethyl, Bis(cyclopropyl)methyl, 2,2-Dimethylcyclopropyl-methyl, 2-Phenylcyclopropyl, 2,2-Dichlorcyclopropyl, trans-2-Chlorcyclopropyl, cis-2-Chlorcyclopropyl, 2,2-Difluorcyclopropyl, trans-2-Fluorcyclopropyl, cis-2-Fluorcyclopropyl, trans-4-Hydroxycyclohexyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl, Prop-2-enyl, 2-Methylprop-2-enyl, Prop-2-inyl, 1,1-Dimethylbut-2-inyl, 3-Chlor-prop-2-enyl, 3-Fluor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-1,1-dimethylprop-2-enyl, Oxetan-3-yl, Thietan-3-yl, 1-Oxido-thietan-3-yl, 1,1-Dioxido-thietan-3-yl, Isoxazol-3-ylmethyl, 1,2,4-Triazol-3-ylmethyl, 3-Methyloxetan-3-ylmethyl, Benzyl, 2,6-Difluorphenylmethyl, 3-Fluorphenylmethyl, 2-Fluorphenylmethyl, 2,5-Difluorphenylmethyl, 1-Phenylethyl, 4-Chlorphenylethyl, 2-Trifluormethylphenylethyl, 1-Pyridin-2-ylethyl, Pyridin-2-ylmethyl, 5-Fluorpyridin-2-ylmethyl, (6-Chlor-pyridin-3-yl)methyl, Pyrimidin-2-ylmethyl, Methoxy, 2-Ethoxyethyl, 2-Methoxyethyl, 2-(Methylsulfanyl)ethyl, 1-Methyl-2-(ethylsulfanyl)ethyl, 2-Methyl-1-(methylsulfanyl)propan-2-yl, Methoxycarbonyl, Methoxycarbonylmethyl, NH<sub>2</sub>, N-Ethylamino, N-Allylamino, N,N-Dimethylamino, N,N-Diethylamino steht; oder

35 Q für ein mit 0, 1, 2, 3 oder 4 Substituenten V substituiertes Phenyl, Naphthyl, Pyridazin, Pyrazin, Pyrimidin, Triazin, Pyridin, Pyrazol, Thiazol, Isothiazol, Oxazol, Isoxazol, Triazol, Imidazol, Furan, Thiophen, Pyrrol, Oxadiazol, Thiadiazol steht, wobei

40 V unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, N-Methoxyiminomethyl, 1-(N-Methoxyimino)-ethyl, Methylsulfanyl, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfanyl, N,N-Dimethylamino steht;

50 T für einen der nachfolgend aufgeführten 5 gliedrigen Heteroaromaten T1-T7 steht, wobei die Bindung zur Pyrazolkopfguppe mit einem Sternchen gekennzeichnet ist,





5

wobei

10  $R^6$  unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, Trifluormethylcarbonyl, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfinyl, und

15  $n$  für die Werte 0-1 stehen;

20  $Z^1$  für Methyl, Ethyl, 1,1-Dimethylethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Bromdichlormethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Cyclopropyl, 1-Chlorcyclopropyl, 1-Fluorcyclopropyl, 1-Bromcyclopropyl, 1-Cyan-cyclopropyl, 1-Trifluormethyl-cyclopropyl, Cyclobutyl und 2,2-Difluor-1-methyl-cyclopropyl, und

25  $Z^2$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Methyl, Ethyl, 1,1-Dimethylethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Bromdichlormethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylthio, Ethylsulfinyl, Ethylsulfonyl, Trifluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlor-difluormethylsulfanyl, Chlordifluormethylsulfinyl, Chlor-difluormethylsulfonyl, Dichlor-fluormethylsulfanyl, Dichlor-fluormethylsulfinyl, Dichlor-fluormethylsulfonyl und

30  $Z^3$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl, t-Butyl, Ethenyl, 1-Propenyl, 1-Propinyl, 1-Butinyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Phenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, 2,5-Dichlorphenyl, 3,4-Dichlorphenyl, 2,6-Dichlorphenyl, 2,6-Dichlor-4-trifluormethylphenyl, 3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl stehen;

40 **[0012]** Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in denen

$Z^1$  für Trifluormethyl, 1-Chlor-cyclopropyl, 1-Fluor-cyclopropyl oder Pentafluorethyl steht,  
 $Z^2$  für Trifluormethyl, Nitro, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Fluor, Chlor, Brom, Cyano oder Iod steht,

$Z^3$  für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder Wasserstoff steht,

45  $R^1$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, s-Butylcarbonyl, t-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, s-Butoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Benzyl, 4-Methoxybenzyl, Pyridin-2-yl-methyl, Pyridin-3-yl-methyl, Pyridin-4-yl-methyl, 4-Chlor-pyridin-3-yl-methyl steht,

50  $A^1$ ,  $A^2$  und  $A^4$  jeweils für CH stehen, wobei

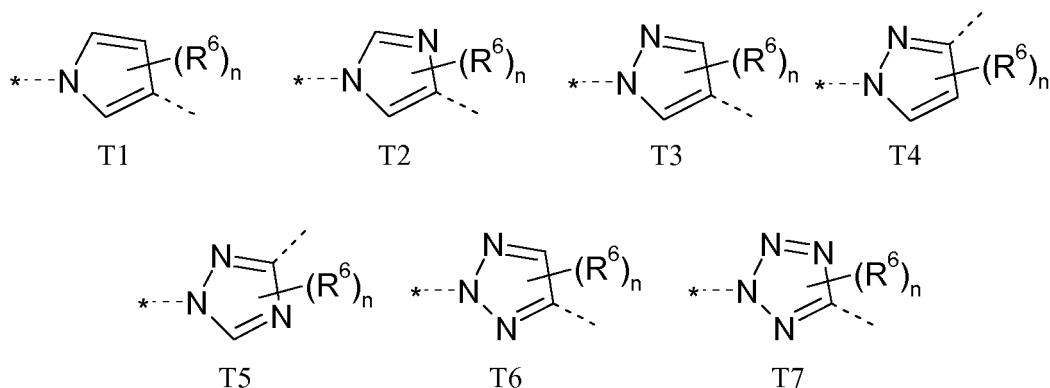
$A^2$  alternativ auch für CH oder N stehen kann,

$A^3$  für  $CR^4$  und

$R^4$  für Fluor, Chlor, Brom oder Iod steht, wobei

$R^4$  alternativ auch für Methyl, Ethyl, Fluor, Chlor, Brom oder Iod stehen kann,

55  $T$  für einen der nachfolgend aufgeführten 5 gliedrigen Heteroaromaten T1-T7 steht, wobei die Bindung zur Pyrazolkopfgruppe mit einem Sternchen gekennzeichnet ist,



15 wobei

$R^6$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, 2-Methylethyl, 2,2-Dimethylethyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Trifluormethyl, Amino steht, oder alternativ

20  $R^6$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, 2-Methylethyl, 2,2-Dimethylethyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Nitro, Trifluormethyl, Amino steht,

W für Sauerstoff steht und

25 Q für für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, 1,1-Dimethylethyl, n-Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 2-Methylbutyl, Hydroxymethyl, 2-Hydroxypropyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-Trifluormethylethyl, 2,2-Difluorpropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 2,2-Dimethyl-3-fluorpropyl, Cyclopropyl, 1-Cyano-cyclopropyl, 1-Methoxycarbonyl-cyclopropyl, 1-(*N*-Methylcarbamoyl)cyclopropyl, 1-(*N*-Cyclopropylcarbamoyl)cyclopropyl, Cyclopropyl-methyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, 1-Cyclopropylethyl, Bis(cyclopropyl)methyl, 2,2-Dimethylcyclopropyl-methyl, 2-Phenylcyclopropyl, 2,2-Dichlorcyclopropyl, trans-2-Chlorcyclopropyl, cis-2-Chlorcyclopropyl, 2,2-Difluorcyclopropyl, trans-2-Fluorcyclopropyl, cis-2-Fluorcyclopropyl, trans-4-Hydroxycyclohexyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl, Prop-2-enyl, 2-Methylprop-2-enyl, Prop-2-inyl, 1,1-Dimethylbut-2-inyl, 3-Chlor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-1,1-dimethylprop-2-enyl, Phenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, Oxetan-3-yl, Thietan-3-yl, 1-Oxido-thietan-3-yl, 1,1-Dioxido-thietan-3-yl, Isoxazol-3-ylmethyl, 1,2,4-Triazol-3-ylmethyl, 3-Methyloxetan-3-ylmethyl, Benzyl, 2,6-Difluorphenylmethyl, 3-Fluorphenylmethyl, 2-Fluorphenylmethyl, 2,5-Difluorphenylmethyl, 1-Phenylethyl, 4-Chlorphenylethyl, 2-Trifluormethylphenylethyl, 1-Pyridin-2-ylethyl, Pyridin-2-ylmethyl, (6-Chlor-pyridin-3-yl)methyl, 5-Fluorpyridin-2-ylmethyl, Pyrimidin-2-ylmethyl, Methoxy, 2-Ethoxyethyl, 2-(Methylsulfanyl)ethyl, 1-Methyl-2-(ethylsulfanyl)ethyl, 2-Methyl-1-(methylsulfanyl)propan-2-yl, Methoxycarbonyl, Methoxycarbonylmethyl,  $NH_2$ , *N*-Ethylamino, *N*-Allylamino, *N,N*-Dimethylamino, *N,N*-Diethylamino steht; oder alternativ

30  
35  
40

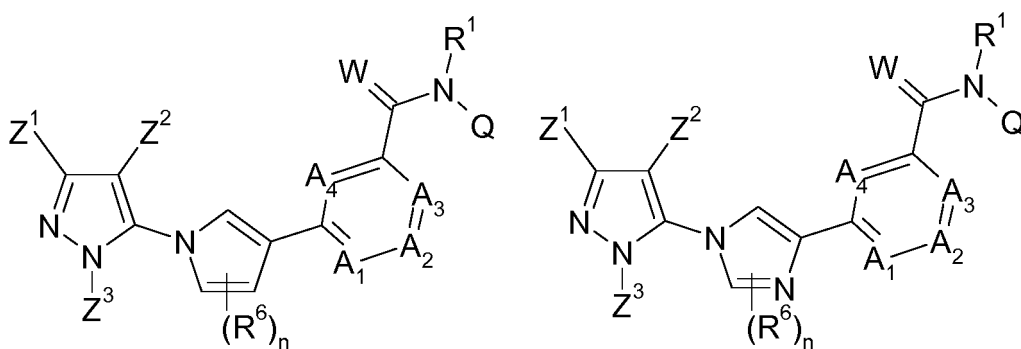
Q für für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, 1,1-Dimethylethyl, n-Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 2-Methylbutyl, Hydroxyethyl, 2-Hydroxypropyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-Trifluormethylethyl, 2,2-Difluorpropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 2,2-Dimethyl-3-fluorpropyl, Cyclopropyl, 1-Cyano-cyclopropyl, 1-Methoxycarbonyl-cyclopropyl, 1-(*N*-Methylcarbamoyl)cyclopropyl, 1-carbamoyl-cyclopropyl, 1-Carbamothioyl-cyclopropyl, 1-(*N*-Cyclopropylcarbamoyl)cyclopropyl, Cyclopropyl-methyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, 1-Cyclopropylethyl, Bis(cyclopropyl)methyl, 2,2-Dimethylcyclopropyl-methyl, 2-Phenylcyclopropyl, 2,2-Dichlorcyclopropyl, trans-2-Chlorcyclopropyl, cis-2-Chlorcyclopropyl, 2,2-Difluorcyclopropyl, trans-2-Fluorcyclopropyl, cis-2-Fluorcyclopropyl, trans-4-Hydroxycyclohexyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl, Prop-2-enyl, 2-Methylprop-2-enyl, Prop-2-inyl, 1,1-Dimethylbut-2-inyl, 3-Chlor-prop-2-enyl, 3-Fluor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-1,1-dimethylprop-2-enyl, Oxetan-3-yl, Thietan-3-yl, 1-Oxido-thietan-3-yl, 1,1-Dioxido-thietan-3-yl, Isoxazol-3-ylmethyl, 1,2,4-Triazol-3-ylmethyl, 3-Methyloxetan-3-ylmethyl, Benzyl, 2,6-Difluorphenylmethyl, 3-Fluorphenylmethyl, 2-Fluorphenylmethyl, 2,5-Difluorphenylmethyl, 1-Phenylethyl, 4-Chlorphenylethyl, 2-Trifluormethylphenylethyl, 1-Pyridin-2-ylethyl, Pyridin-2-ylmethyl, (6-Chlor-pyridin-3-yl)methyl, 5-Fluorpyridin-2-ylmethyl, Pyrimidin-2-ylmethyl, Methoxy, 2-Ethoxyethyl, 2-Methoxyethyl, 2-(Methylsulfanyl)ethyl, 1-Methyl-2-(ethylsulfanyl)ethyl, 2-Methyl-1-(methylsulfanyl)propan-2-yl, Methoxycarbonyl, Methoxycarbonylmethyl,  $NH_2$ , *N*-Ethylamino, *N*-Allylamino, *N,N*-Dimethylamino, *N,N*-Diethylamino steht;

45  
50  
55

Q für ein mit 0,1, 2 oder 3 Substituenten V substituiertes Phenyl, Naphthyl, Pyridazin, Pyrazin, Pyrimidin, Triazin, Pyridin, Pyrazol, Thiazol, Isothiazol, Oxazol, Isoxazol, Triazol, Imidazol, Furan, Thiophen, Pyrrol, Oxadiazol, Thiadiazol steht, wobei

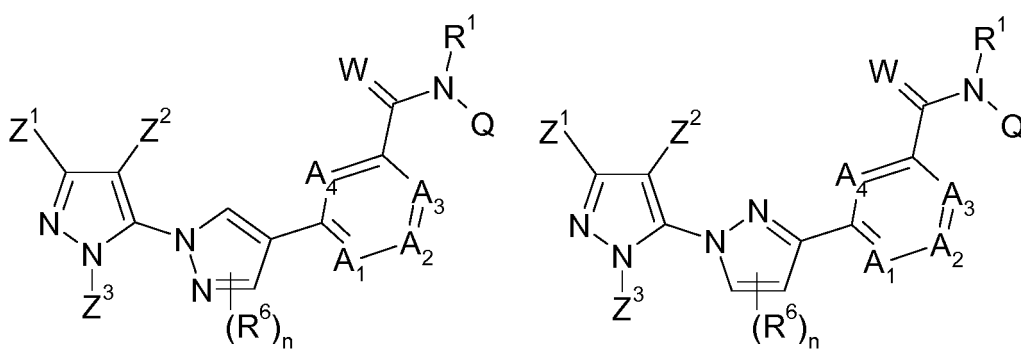
V unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, *N*-Methoxyiminomethyl, 1-(*N*-Methoxyimino)-ethyl, Methylsulfanyl, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, *N,N*-Dimethylamino steht;

**[0013]** Besonders speziell bevorzugt sind ferner die Verbindungen, die jeweils durch eine der allgemeinen Formeln I(a), I(b), I(c), I(d), I(e), I(f), I(g) definiert sind, in denen die Reste  $A_1$ - $A_4$ ,  $n$ ,  $W$ ,  $Q$ ,  $R^1$  und  $Z^1$ - $Z^3$  die oben jeweils beschriebenen allgemeinen, bevorzugten oder besonders bevorzugten Bedeutungen haben.



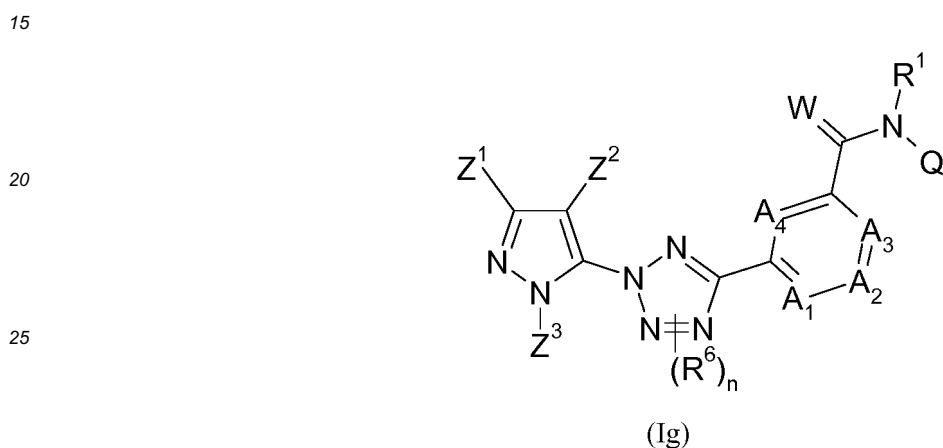
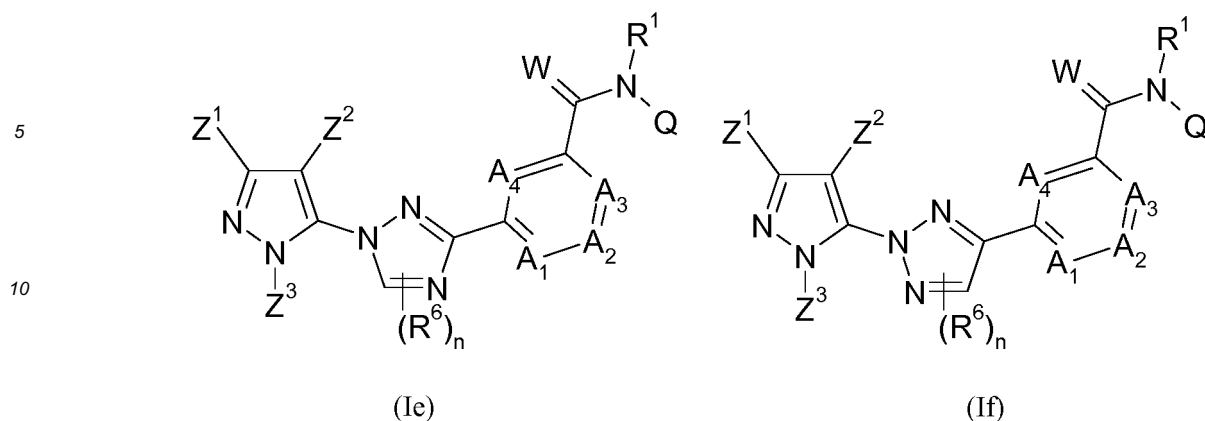
(Ia)

(Ib)



(Ic)

(Id)



30 **[0014]** Insbesondere bevorzugt sind alle Verbindungen der allgemeinen Formel (Ic), wobei die Vorzugsbereiche für die Reste A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>6</sup>, W, Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup> und Z<sup>3</sup> entsprechend den vorgehenden Vorzugsbereichen für die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gelten.

35 **[0015]** Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (Ia), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für CH<sub>3</sub>, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup> und R<sup>6c</sup> für Wasserstoff stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>3</sup> für C-C1, W für Sauerstoff und Q für 1-Cyano-cyclopropyl oder Cyclopropyl stehen,

Ganz besonders bevorzugt sind alternativ Verbindungen der allgemeinen Formel (Ia), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für CH<sub>3</sub>, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup> und R<sup>6c</sup> für Wasserstoff stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>2</sup> für N steht, A<sup>3</sup> für C-C1, W für Sauerstoff und Q für 1-Cyano-cyclopropyl oder Cyclopropyl stehen,

40 Ganz besonders bevorzugt sind ferner Verbindungen der allgemeinen Formel (Ib), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für CH<sub>3</sub>, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup> und R<sup>6b</sup> für Wasserstoff stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>3</sup> für C-C1, W für Sauerstoff und Q für 1-Cyano-cyclopropyl oder Cyclopropyl stehen,

Ganz besonders bevorzugt sind alternativ Verbindungen der allgemeinen Formel (Ib), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für CH<sub>3</sub>, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup> und R<sup>6c</sup> für Wasserstoff stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>2</sup> für N steht, A<sup>3</sup> für C-C1, W für Sauerstoff und Q für 1-Cyano-cyclopropyl oder Cyclopropyl stehen,

45 Ganz besonders bevorzugt sind ferner Verbindungen der allgemeinen Formel (Ic), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für Methyl, Ethyl, Phenyl, 4-NO<sub>2</sub>-Phenyl, 3-chlorpyridin-2-yl, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup> für Wasserstoff oder Methyl, R<sup>6b</sup> für Wasserstoff, Methyl oder CF<sub>3</sub> stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sub>2</sub> für C-H oder C-F stehen, A<sub>3</sub> für C-H oder C-C1 stehen, W für Sauerstoff steht und Q für einen der Reste 1-Cyano-cyclopropyl, Benzyl, Cyclopropyl, 2-Thienylmethyl, Carbamthioylcyclopropyl, Pyrid-4-yl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methylsulfonyl, Thietan-3-yl, 1-Carbamoylcyclopropyl steht.

50 **[0016]** Ganz besonders bevorzugt sind alternativ Verbindungen der allgemeinen Formel (Ic), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für Methyl, Ethyl, Phenyl, 4-NO<sub>2</sub>-Phenyl, 3-chlorpyridin-2-yl, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup> für Wasserstoff oder Methyl, R<sup>6b</sup> für Wasserstoff, Methyl oder CF<sub>3</sub> stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sub>2</sub> für N steht, A<sub>3</sub> für C-H oder C-C1 stehen, W für Sauerstoff steht und Q für einen der Reste 1-Cyano-cyclopropyl, Benzyl, Cyclopropyl, 2-Thienylmethyl, Carbamthioylcyclopropyl, Pyrid-4-yl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methylsulfonyl, Thietan-3-yl, 1-Carbamoylcyclopropyl steht.

55 **[0017]** Ganz besonders bevorzugt sind ferner Verbindungen der allgemeinen Formel (Id), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für CH<sub>3</sub>, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup> und R<sup>6b</sup> für Wasserstoff stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>3</sup> für C-Cl, W für Sauerstoff und Q für 1-Cyano-cyclopropyl oder Cyclopropyl stehen,

Ganz besonders bevorzugt sind alternativ Verbindungen der allgemeinen Formel (Id), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup>

für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für CH<sub>3</sub>, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup> und R<sup>6c</sup> für Wasserstoff stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>2</sup> für N steht, A<sup>3</sup> für C-C1, W für Sauerstoff und Q für 1-Cyano-cyclopropyl oder Cyclopropyl stehen,

Ganz besonders bevorzugt sind ferner Verbindungen der allgemeinen Formel (Ie), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für CH<sub>3</sub>, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup> und R<sup>6b</sup> für Wasserstoff stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>3</sup> für C-Cl, W für Sauerstoff und Q für einen der Reste 1-Cyano-cyclopropyl, 2-Thienylmethyl, 6-Chlorpyridin-3-yl, 1-Carbamothioylcyclopropyl oder Cyclopropyl stehen,

Ganz besonders bevorzugt sind alternativ Verbindungen der allgemeinen Formel (Ie), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für CH<sub>3</sub>, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup> und R<sup>6b</sup> für Wasserstoff stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>2</sup> für N steht, A<sup>3</sup> für C-C1, W für Sauerstoff und Q für einen der Reste 1-Cyano-cyclopropyl, 2-Thienylmethyl, 6-Chlorpyridin-3-yl, 1-Carbamothioylcyclopropyl oder Cyclopropyl stehen.

**[0018]** Am meisten bevorzugt sind die Verbindungen der allgemeinen Formel (Ic), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für Methyl, Ethyl, Phenyl, 4-NO<sub>2</sub>-Phenyl, 3-chlorpyridin-2-yl, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup> für Wasserstoff oder Methyl, R<sup>6b</sup> für Wasserstoff, Methyl oder CF<sub>3</sub> stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>2</sup> für C-H oder C-F stehen, A<sup>3</sup> für C-H oder C-C1 stehen, W für Sauerstoff steht und Q für einen der Reste 1-Cyano-cyclopropyl, Benzyl, Cyclopropyl, 2-Thienylmethyl, Carbamothioylcyclopropyl, Pyrid-4-yl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methylsulfonyl, Thietan-3-yl, 1-Carbamoylcyclopropyl steht.

**[0019]** Am meisten bevorzugt sind alternativ die Verbindungen der allgemeinen Formel (Ic), in denen Z<sup>1</sup> für CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht, Z<sup>2</sup> für CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> für Methyl, Ethyl, Phenyl, 4-NO<sub>2</sub>-Phenyl, 3-chlorpyridin-2-yl, die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>6a</sup> für Wasserstoff oder Methyl, R<sup>6b</sup> für Wasserstoff, Methyl oder CF<sub>3</sub> stehen, A<sup>1</sup>, A<sup>4</sup> für C-H stehen, A<sup>2</sup> für N steht, A<sup>3</sup> für C-H oder C-Cl stehen, W für Sauerstoff steht und Q für einen der Reste 1-Cyano-cyclopropyl, Benzyl, Cyclopropyl, 2-Thienylmethyl, Carbamothioylcyclopropyl, Pyrid-4-yl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methylsulfonyl, Thietan-3-yl, 1-Carbamoylcyclopropyl steht.

**[0020]** Erfindungsgemäß steht "Alkyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettige oder verzweigte Kohlenstoffwasserstoffe, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl, t-Butyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,1-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 1,4-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 1,1-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethylbutyl und 2-Ethylbutyl. Ferner bevorzugt für Alkyle mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, wie unter anderem Methyl, Ethyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl oder t-Butyl. Die erfindungsgemäßen Alkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0021]** Erfindungsgemäß steht "Alkenyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettige oder verzweigte Kohlenstoffwasserstoffe, vorzugsweise mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und mindestens einer Doppelbindung, wie beispielsweise Vinyl, 2-Propenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 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-2-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl. Ferner bevorzugt für Alkenyle mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, wie unter anderem 2-Propenyl, 2-Butenyl oder 1-Methyl-2-propenyl. Die erfindungsgemäßen Alkenyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0022]** Erfindungsgemäß steht "Alkynyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettige oder verzweigte Kohlenstoffwasserstoffe, vorzugsweise mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und mindestens einer Dreifachbindung wie beispielsweise 2-Propinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 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-4-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl und 2,5-Hexadiynyl. Ferner bevorzugt für Alkynyle mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen wie unter anderem Ethinyl, 2-Propinyl oder 2-Butinyl-2-propenyl. Die erfindungsgemäßen Alkynyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0023]** Erfindungsgemäß steht "Cycloalkyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für mono-, bi- oder tricyclische Kohlenwasserstoffe, vorzugsweise mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen wie beispielsweise Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Bicyclo[2.2.1]heptyl, Bicyclo[2.2.2]octyl oder Adamantyl. Ferner bevorzugt für Cycloalkyle mit 3, 4, 5, 6 oder 7 Kohlenstoffatomen, wie unter anderem Cyclopropyl oder Cyclobutyl. Die erfindungsgemäßen Cycloalkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0024]** Erfindungsgemäß steht "Alkylcycloalkyl" für mono-, bi- oder tricyclisches Alkylcycloalkyl, vorzugsweise mit 4

bis 10 oder 4 bis 7 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Ethylcyclopropyl, Isopropylcyclobutyl, 3-Methylcyclopentyl und 4-Methyl-cyclohexyl. Ferner bevorzugt für Alkylcycloalkyle mit 4, 5 oder 7 Kohlenstoffatomen wie unter anderen Ethylcyclopropyl oder 4-Methyl-cyclohexyl. Die erfindungsgemäßen Alkylcycloalkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0025]** Erfindungsgemäß steht "Cycloalkylalkyl" für mono-, bi- oder tricyclisches Cycloalkylalkyl, vorzugsweise mit 4 bis 10 oder 4 bis 7 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl und Cyclopentylethyl. Ferner bevorzugt für Cycloalkylalkyle mit 4, 5 oder 7 Kohlenstoffatomen wie unter anderen Cyclopropylmethyl oder Cyclobutylmethyl. Die erfindungsgemäßen Cycloalkylalkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0026]** Erfindungsgemäß steht "Halogen" für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, insbesondere für Fluor, Chlor oder Brom.

**[0027]** Die erfindungsgemäßen mit Halogen substituierten chemischen Gruppen, wie beispielsweise Halogenalkyl, Halogencycloalkyl, Halogenalkyloxy, HalogenAlkylsulfanyl, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl sind einfach oder mehrfach bis zur maximal möglichen Substituentenzahl mit Halogen substituiert. Bei mehrfacher Substitution mit Halogen, können die Halogenatome gleich oder verschieden sein und können alle an eines oder an mehrere Kohlenstoffatome gebunden sein. Dabei steht Halogen insbesondere für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom und besonders bevorzugt für Fluor.

**[0028]** Erfindungsgemäß steht "Halogencycloalkyl" für mono-, bi- oder tricyclisches Halogencycloalkyl, vorzugsweise mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen, wie unter anderen 1-Fluor-cyclopropyl, 2-Fluor-cyclopropyl oder 1-Fluor-cyclobutyl. Ferner bevorzugt für Halogencycloalkyl mit 3, 5 oder 7 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Halogencycloalkyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0029]** Erfindungsgemäß steht "Halogenalkyl" "Halogenalkenyl" oder "Halogenalkinyl" für mit Halogen substituierte Alkyle, Alkenyle oder Alkinylen mit vorzugsweise 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, wie beispielsweise Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl) wie  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHClCH}_3$ ,  $\text{CHFCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ; Perhaloalkyl wie  $\text{CCl}_3$  oder  $\text{CF}_3$  oder  $\text{CF}_2\text{CF}_3$ ; Polyhaloalkyl wie  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHCl}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ . Entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierten Reste. Haloalkoxy ist z.B.  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{OCHF}_2$ ,  $\text{OCH}_2\text{F}$ ,  $\text{OCF}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  und  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ;

**[0030]** Weitere Beispiele für Halogenalkyle sind Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, Pentafluorethyl und Pentafluor-t-butyl. Bevorzugt sind Halogenalkyle mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9, vorzugsweise 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, die ausgewählt sind unter Fluor, Chlor oder Brom. Besonders bevorzugt sind Halogenalkyle mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und mit 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, die ausgewählt sind unter Fluor oder Chlor, wie unter anderen Difluormethyl, Trifluormethyl oder 2,2-Difluorethyl.

**[0031]** Erfindungsgemäß steht "Hydroxyalkyl" für geradkettigen oder verzweigten Alkohol, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol, Isobutanol, s-Butanol und t-Butanol. Ferner bevorzugt für Hydroxyalkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Hydroxyalkylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein

**[0032]** Erfindungsgemäß steht "Alkoxy" für geradkettiges oder verzweigtes O-Alkyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, Isopropoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, s-Butoxy und t-Butoxy. Ferner bevorzugt für Alkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Alkoxygruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0033]** Erfindungsgemäß steht "Halogenalkoxy" für mit Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes O-Alkyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie unter anderem Difluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy. Ferner bevorzugt für Halogenalkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Halogenalkoxygruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0034]** Erfindungsgemäß steht "Alkylsulfanyl" für geradkettiges oder verzweigtes S-Alkyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, Isopropylthio, n-Butylthio, Isobutylthio, s-Butylthio und t-Butylthio. Ferner bevorzugt für Alkylsulfanylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Alkylsulfanylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0035]** Beispiele für Halogenalkylsulfanylalkyle, d.h. mit Halogen substituierte Alkylsulfanylgruppen, sind unter anderem Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trichlormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 1,1,2,2-Tetrafluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio oder 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylthio.

**[0036]** Erfindungsgemäß steht "Alkylsulfinyl" für geradkettiges oder verzweigtes Alkylsulfinyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie beispielsweise Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n-Propylsulfinyl, Isopropylsulfinyl, n-Butylsulfinyl, Isobutylsulfinyl, s-Butylsulfinyl und t-Butylsulfinyl. Ferner bevorzugt für Alkylsulfinylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Alkylsulfinylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0037]** Beispiele für Halogenalkylsulfinylgruppen, d.h. mit Halogen substituierte Alkylsulfinylgruppen, sind unter ande-

rem Difluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Trichlormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl, 1-Fluorethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylsulfinyl.

**[0038]** Erfindungsgemäß steht "Alkylsulfonyl" für geradkettiges oder verzweigtes Alkylsulfonyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen wie beispielsweise Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n-Propylsulfonyl, Isopropylsulfonyl, n-Butylsulfonyl, Isobutylsulfonyl, s-Butylsulfonyl und t-Butylsulfonyl. Ferner bevorzugt für Alkylsulfonylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Alkylsulfonylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0039]** Beispiele für Halogenalkylsulfonylgruppen, d.h. mit Halogen substituierte Alkylsulfonylgruppen sind unter anderem Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, 1-Fluorethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylsulfonyl.

**[0040]** Erfindungsgemäß steht "Alkylcarbonyl" für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl-C(=O), vorzugsweise mit 2 bis 7 Kohlenstoffatomen, wie Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, s-Butylcarbonyl und t-Butylcarbonyl. Ferner bevorzugt für Alkylcarbonyle mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Die erfindungsgemäßen Alkylcarbonyle können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0041]** Erfindungsgemäß steht "Cycloalkylcarbonyl" für geradkettiges oder verzweigtes Cycloalkylcarbonyl, vorzugsweise mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil, wie beispielsweise Cyclopropylcarbonyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyclohexyl-carbonyl, Cycloheptylcarbonyl, Cyclooctylcarbonyl, Bicyclo[2.2.1]heptyl, Bicyclo[2.2.2]octylcarbonyl und Adamantylcarbonyl. Ferner bevorzugt für Cycloalkylcarbonyl mit 3, 5 oder 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil. Die erfindungsgemäßen Cycloalkylcarbonylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0042]** Erfindungsgemäß steht "Alkoxy-carbonyl" - in Alleinstellung oder als Bestandteil einer chemischen Gruppe - für geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl, vorzugsweise mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, wie beispielsweise Methoxy-carbonyl, Ethoxy-carbonyl, n-Propoxy-carbonyl, Isopropoxy-carbonyl, s-Butoxy-carbonyl und t-Butoxy-carbonyl. Die erfindungsgemäßen Alkoxy-carbonylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0043]** Erfindungsgemäß steht "Alkylaminocarboxyl" für geradkettiges oder verzweigtes Alkylaminocarboxyl mit vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, wie beispielsweise Methylaminocarboxyl, Ethylaminocarboxyl, n-Propylaminocarboxyl, Isopropylaminocarboxyl, s-Butylaminocarboxyl und t-Butylaminocarboxyl. Die erfindungsgemäßen Alkylaminocarboxylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0044]** Erfindungsgemäß steht "*N,N*-Dialkylamino-carboxyl" für geradkettiges oder verzweigtes *N,N*-Dialkylaminocarboxyl mit vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, wie beispielsweise *N,N*-Dimethylamino-carboxyl, *N,N*-Diethylamino-carboxyl, *N,N*-Di(*n*-propylamino)-carboxyl, *N,N*-Di-(isopropylamino)-carboxyl und *N,N*-Di-(*s*-butylamino)-carboxyl. Die erfindungsgemäßen *N,N*-Dialkylamino-carboxylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0045]** Erfindungsgemäß steht "Aryl" für ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System mit vorzugsweise 6 bis 14, insbesondere 6 bis 10 Ring-Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Anthryl, Phenanthrenyl, vorzugsweise Phenyl. Ferner steht Aryl auch für mehrcyclische Systeme, wie Tetrahydronaphtyl, Indenyl, Indanyl, Fluorenyl, Biphenyl, wobei die Bindungsstelle am aromatischen System ist. Die erfindungsgemäßen Arylgruppen können mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0046]** Beispiele substitutierter Aryle stellen die Arylalkyle dar, die gleichfalls mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten im Alkyl- und/oder Arylteil substituiert sein können. Beispiele solcher Arylalkyle sind unter anderem Benzyl und 1-Phenylethyl.

**[0047]** Erfindungsgemäß steht "Heterocyclus", "heterocyclischer Ring" oder "heterocyclisches Ringsystem" für ein carbocyclisches Ringsystem mit mindestens einem Ring, in dem mindestens ein Kohlenstoffatom durch ein Heteroatom ersetzt ist, vorzugsweise durch ein Heteroatom aus der Gruppe N, O, S, P, B, Si, Se und der gesättigt, ungesättigt oder heteroaromatisch ist und dabei unsubstituiert oder mit einem Substituenten Z substituiert sein kann, wobei die Bindungsstelle an einem Ringatom lokalisiert ist. Wenn nicht anders definiert, enthält der heterocyclische Ring vorzugsweise 3 bis 9 Ringatome, insbesondere 3 bis 6 Ringatome, und ein oder mehrere, vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1, 2 oder 3 Heteroatome im heterocyclischen Ring, vorzugsweise aus der Gruppe N, O, und S, wobei jedoch nicht zwei Sauerstoffatome direkt benachbart sein sollen. Die heterocyclischen Ringe enthalten gewöhnlicherweise nicht mehr als 4 Stickstoffatome, und/oder nicht mehr als 2 Sauerstoffatome und/oder nicht mehr als 2 Schwefelatome. Ist der Heterocyclrest oder der heterocyclische Ring gegebenenfalls substituiert, kann er mit anderen carbocyclischen oder heterocyclischen Ringen annelliert sein. Im Falle von gegebenenfalls substituiertem Heterocycl werden erfindungsgemäß auch mehrcyclische Systeme umfasst, wie beispielsweise 8-Aza-bicyclo[3.2.1]octanyl oder 1-Aza-bicyclo[2.2.1]heptyl. Im Falle von gegebenenfalls substituiertem Heterocycl werden erfindungsgemäß auch spirocyclische Systeme umfasst,

wie beispielsweise 1-Oxa-5-aza-spiro[2.3]hexyl.

**[0048]** Erfindungsgemäße Heterocyclgruppen sind beispielsweise Piperidiny, Piperaziny, Morpholiny, Thiomorpholiny, Dihydropyranly, Tetrahydropyranly, Dioxanly, Pyrroliny, Pyrrolidinly, Imidazoliny, Imidazolidiny, Thiazolidiny, Oxazolidiny, Dioxolanly, Dioxoly, Pyrazolidiny, Tetrahydrofuranly, Dihydrofuranly, Oxetanly, Oxiranly, Azetidiny, Aziridinly, Oxazetidiny, Oxaziridinly, Oxazepanly, Oxazinanly, Azepanly, Oxopyrrolidinly, Dioxopyrrolidinly, Oxomorpholiny, Oxopiperazinly und Oxepanly.

**[0049]** Eine besondere Bedeutung kommt Heteroarylen, also heteroaromatischen Systemen zu. Erfindungsgemäß steht der Ausdruck Heteroaryl für heteroaromatische Verbindungen, das heißt vollständig ungesättigte aromatische heterocyclische Verbindungen, die unter die vorstehende Definition von Heterocyclen fallen. Vorzugsweise für 5- bis 7-gliedrige Ringe mit 1 bis 3, vorzugsweise 1 oder 2 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen aus der oben genannten Gruppe. Erfindungsgemäße Heteroaryle sind beispielsweise Fury, Thieny, Pyrazoly, Imidazolyl, 1,2,3- und 1,2,4-Triazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- und 1,2,5-Oxadiazolyl, Azepiny, Pyrroly, Pyridyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, Pyrazinyl, 1,3,5-, 1,2,4- und 1,2,3-Triazinyl, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- und 1,2,6-Oxazinyl, Oxepiny, Thiopiny, 1,2,4-Triazolonyl und 1,2,4-Diazepiny. Die erfindungsgemäßen Heteroarylgruppen können ferner mit einem oder mehreren, gleichen oder verschiedenen Resten substituiert sein.

**[0050]** Substituierte Gruppen, wie ein substituierter Alkyl-, Alkenyl-, Alkiny-, Cycloalkyl-, Aryl-, Phenyl-, Benzyl-, Heterocycl- und Heteroarylrest, bedeuten beispielsweise einen vom unsubstituierten Grundkörper abgeleiteten substituierten Rest, wobei die Substituenten beispielsweise einen oder mehrere, vorzugsweise 1, 2 oder 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Alkylsulfanyl, Hydroxy, Amino, Nitro, Carboxy oder eine der Carboxygruppe äquivalente Gruppe, Cyano, Isocyano, Azido, Alkoxy-carbonyl, Alkyl-carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und *N,N*-Dialkylamino-carbonyl, substituiertes Amino, wie Acylamino, Mono- und *N,N*-Dialkylamino, Trialkylsilyl und gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Heterocycl, wobei jeder der letztgenannten cyclischen Gruppen auch über Heteroatome oder divalente funktionelle Gruppen wie bei den genannten Alkylresten gebunden sein kann, und Alkylsulfiny, wobei beide Enantiomere der Alkylsulfonylgruppe umfasst sind, Alkylsulfonyl, Alkylphosphiny, Alkylphosphonyl und, im Falle cyclischer Reste (= "cyclischer Grundkörper"), auch Alkyl, Haloalkyl, Alkylsulfanylalkyl, Alkoxy-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Mono- und *N,N*-Dialkyl-aminoalkyl und Hydroxyalkyl bedeutet.

**[0051]** Im Begriff "substituierte Gruppen" wie substituiertes Alkyl etc. sind als Substituenten zusätzlich zu den genannten gesättigten kohlenwasserstoffhaltigen Resten entsprechende ungesättigte aliphatische und aromatische Reste, wie gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Alkiny, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkenylthio, Alkinythio, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkiny-carbonyl, Mono- und *N,N*-Dialkenylamino-carbonyl, Mono- und Dialkylamino-carbonyl, Mono- und *N,N*-Dialkenylamino, Mono- und *N,N*-Dialkylamino, Trialkenylsilyl, Trialkenylsilyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkenyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkenyl, Phenyl, Phenoxy etc. eingeschlossen. Im Falle von substituierten cyclischen Resten mit aliphatischen Anteilen im Ring werden auch cyclische Systeme mit solchen Substituenten umfasst, die mit einer Doppelbindung am Ring gebunden sind, z. B. mit einer Alkyldengruppe wie Methylen oder Ethylen oder einer Oxogruppe, Iminogruppe sowie einer substituierten Iminogruppe.

**[0052]** Wenn zwei oder mehrere Reste einen oder mehrere Ringe bilden, so können diese carbocyclisch, heterocyclisch, gesättigt, teilgesättigt, ungesättigt, beispielsweise auch aromatisch und weiter substituiert sein.

**[0053]** Die beispielhaft genannten Substituenten ("erste Substituentenebene") können, sofern sie kohlenwasserstoffhaltige Anteile enthalten, dort gegebenenfalls weiter substituiert sein ("zweite Substituentenebene"), beispielsweise durch einen der Substituenten, wie er für die erste Substituentenebene definiert ist. Entsprechende weitere Substituentenebenen sind möglich. Vorzugsweise werden vom Begriff "substituierter Rest" nur ein oder zwei Substituentenebenen umfasst.

**[0054]** Bevorzugte Substituenten für die Substituentenebenen sind beispielsweise

**[0055]** Amino, Hydroxy, Halogen, Nitro, Cyano, Isocyano, Mercapto, Isothiocyanato, Carboxy, Carbonamid, SF<sub>5</sub>, Aminosulfonyl, Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Cycloalkenyl, Alkiny, *N*-Mono-alkyl-amino, *N,N*-Dialkylamino, *N*-Alkanoylamino, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkoxy, Cycloalkenyloxy, Alkoxy-carbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Aryloxycarbonyl, Alkanoyl, Alkenylcarbonyl, Alkiny-carbonyl, Arylcarbonyl, Alkylsulfanyl, Cycloalkylsulfanyl, Alkenylthio, Cycloalkenylthio, Alkinythio, Alkylsulfenyl und Alkylsulfiny, wobei beide Enantiomere der Alkylsulfinylgruppe umfasst sind, Alkylsulfonyl, *N*-Mono-alkyl-aminosulfonyl, *N,N*-Dialkyl-aminosulfonyl, Alkylphosphiny, Alkylphosphonyl, wobei für Alkylphosphiny bzw. Alkylphosphonyl beide Enantiomere umfasst sind, *N*-Alkyl-aminocarbonyl, *N,N*-Dialkyl-amino-carbonyl, *N*-Alkanoylamino-carbonyl, *N*-Alkanoyl-*N*-alkyl-aminocarbonyl, Aryl, Aryloxy, Benzyl, Benzylloxy, Benzylthio, Arylthio, Arylamino, Benzylamino, Heterocycl und Trialkylsilyl.

**[0056]** Substituenten, die aus mehreren Substituentenebenen zusammengesetzt sind, sind bevorzugt Alkoxyalkyl, Alkylsulfanylalkyl, Alkylsulfanylalkoxy, Alkoxyalkoxy, Phenethyl, Benzylloxy, Halogenalkyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylsulfanyl, Halogenalkylsulfiny, Halogenalkylsulfonyl, Halogenalkanoyl, Halogenalkylcarbonyl, Halogenalkoxy-carbonyl, Halogenalkoxyalkoxy, Halogenalkoxyalkylsulfanyl, Halogenalkoxyalkanoyl, Halogenalkoxyalkyl.

**[0057]** Bei Resten mit C-Atomen sind solche mit 1 bis 6 C-Atomen, vorzugsweise 1 bis 4 C-Atomen, insbesondere 1 oder 2 C-Atomen bevorzugt. Bevorzugt sind in der Regel Substituenten aus der Gruppe Halogen, z.B. Fluor und Chlor, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, vorzugsweise Methyl oder Ethyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Haloalkoxy, Nitro und Cyano. Besonders bevorzugt sind dabei die Substituenten

Methyl, Methoxy, Fluor und Chlor.

**[0058]** Substituiertes Amino wie mono- oder disubstituiertes Amino bedeutet einen Rest aus der Gruppe der substituierten Aminoreste, welche beispielsweise durch einen bzw. zwei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Alkyl, Hydroxy, Amino, Alkoxy, Acyl und Aryl *N*-substituiert sind; vorzugsweise *N*-Mono- und *N,N*-Dialkylamino, (z.B. Methylamino, Ethylamino, *N,N*-Dimethylamino, *N,N*-Diethylamino, *N,N*-Di-*n*-propylamino, *N,N*-Diisopropylamino oder *N,N*-Dibutylamino), *N*-Mono- oder *N,N*-Dialkoxyalkylaminogruppen (z.B. *N*-Methoxymethylamino, *N*-Methoxyethylamino, *N,N*-Di-(methoxymethyl)-amino oder *N,N*-Di-(methoxyethyl)-amino), *N*-Mono- und *N,N*-Diarylamino, wie gegebenenfalls substituierte Aniline, Acylamino, *N,N*-diacylamino, *N*-Alkyl-*N*-arylamino, *N*-Alkyl-*N*-acylamino sowie gesättigte *N*-Heterocyclen; dabei sind Alkylreste mit 1 bis 4 C-Atomen bevorzugt; Aryl ist dabei vorzugsweise Phenyl oder substituiertes Phenyl; für Acyl gilt dabei die weiter unten genannte Definition, vorzugsweise (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkanoyl. Entsprechendes gilt für substituiertes Hydroxylamino oder Hydrazino.

**[0059]** Erfindungsgemäß umfasst der Begriff "cyclische Aminogruppen" heteroaromatische oder aliphatische Ringsysteme mit einem oder mehreren Stickstoffatomen. Die Heterocyclen sind gesättigt oder ungesättigt, bestehen aus einem oder mehreren, gegebenenfalls kondensierten Ringsystemen und beinhalten gegebenenfalls weitere Heteroatome, wie beispielsweise ein oder zwei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome. Ferner umfasst der Begriff auch solche Gruppen, die einen Spiroring oder verbrücktes Ringsystem aufweisen. Die Anzahl der Atome, die die cyclische Aminogruppe bilden, ist beliebig und kann z.B. im Falle eines Einringssystems aus 3 bis 8 Ringatomen und im Falle eines Zweiringssystems aus 7 bis 11 Atomen.

**[0060]** Beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten monocyclischen Gruppen mit einem Stickstoffatom als Heteroatom seien 1-Azetidinyl, Pyrrolidino, 2-Pyrrolidin-1-yl, 1-Pyrrolyl, Piperidino, 1,4-Dihydropyrazin-1-yl, 1,2,5,6-Tetrahydropyrazin-1-yl, 1,4-Dihydropyridin-1-yl, 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-1-yl, Homopiperidinyl genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten monocyclischen Gruppen mit zwei oder mehreren Stickstoffatomen als Heteroatome seien 1-Imidazolidinyl, 1-Imidazolyl, 1-Pyrazolyl, 1-Triazolyl, 1-Tetrazolyl, 1-Piperazinyl, 1-Homopiperazinyl, 1,2-Dihydro-piperazin-1-yl, 1,2-Dihydro-pyrimidin-1-yl, Perhydropyrimidin-1-yl, 1,4-Diazacycloheptan-1-yl, genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten monocyclischen Gruppen mit einem oder zwei Sauerstoffatomen und einem bis drei Stickstoffatomen als Heteroatome, wie beispielsweise Oxazolidin-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-2-yl, Isoxazol-2-yl, 1,2,3-Oxadiazin-2-yl, Morpholino, beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten monocyclischen Gruppen mit einem bis drei Stickstoffatomen und einem bis zwei Schwefelatomen als Heteroatome seien Thiazolidin-3-yl, Isothiazolin-2-yl, Thiomorpholino, oder Dioxothiomorpholino genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit gesättigten und ungesättigten kondensierten cyclischen Gruppen seien Indol-1-yl, 1,2-Dihydrobenzimidazol-1-yl, Perhydropyrrolo[1,2-*a*]pyrazin-2-yl genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit spirocyclischen Gruppen sei das 2-Azaspiro[4,5]decan-2-yl genannt; beispielhaft für cyclische Aminogruppen mit verbrückten heterocyclischen Gruppen sei das 2-Azabicyclo[2,2,1]heptan-7-yl genannt.

**[0061]** Substituiertes Amino schließt auch quartäre Ammoniumverbindungen (Salze) mit vier organischen Substituenten am Stickstoffatom ein.

**[0062]** Gegebenenfalls substituiertes Phenyl ist vorzugsweise Phenyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylsulfanyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkylsulfanyl, Cyano, Isocyano und Nitro substituiert ist, z.B. *o*-, *m*- und *p*-Tolyl, Dimethylphenyle, 2-, 3- und 4-Chlorphenyl, 2-, 3- und 4-Fluorphenyl, 2-, 3- und 4-Trifluormethyl- und -Trichlormethylphenyl, 2,4-, 3,5-, 2,5- und 2,3-Dichlorphenyl, *o*-, *m*- und *p*-Methoxyphenyl.

**[0063]** Gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl ist vorzugsweise Cycloalkyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkoxy substituiert ist, insbesondere durch einen oder zwei (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylreste substituiert ist,

**[0064]** Gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl ist vorzugsweise Heterocyclyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkoxy, Nitro und Oxo substituiert ist, insbesondere ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Halogenalkyl und Oxo, ganz besonders durch einen oder zwei (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkylreste substituiert ist.

**[0065]** Beispiele für Alkyl substituierte Heteroaryle sind Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrazolylmethyl, Imidazolylmethyl, 1,2,3- und 1,2,4-Triazolylmethyl, Isoxazolylmethyl, Thiazolylmethyl, Isothiazolylmethyl, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- und 1,2,5-

Oxadiazolymethyl, Azepinylmethyl, Pyrrolylmethyl, Pyridylmethyl, Pyridazinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyrazinylmethyl, 1,3,5-, 1,2,4- und 1,2,3-Triazinylmethyl, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- und 1,2,6-Oxazinylmethyl, Oxepinylmethyl, Thiopinylmethyl und 1,2,4-Diazepinylmethyl.

**[0066]** Erfindungsgemäß geeignete Salze der erfindungsgemäßen Verbindungen, beispielsweise Salze mit Basen oder Säureadditionssalze, sind alle üblichen nicht toxischen Salze, vorzugsweise landwirtschaftlich und/oder physiologisch annehmbare Salze. Beispielsweise Salze mit Basen oder Säureadditionssalze. Bevorzugt werden Salze mit anorganischen Basen, wie beispielsweise Alkalimetallsalze (z.B. Natrium-, Kalium- oder Cäsiumsalze), Erdalkalimetallsalze (z.B. Calcium- oder Magnesiumsalze), Ammoniumsalze oder Salze mit organischen Basen, insbesondere mit organischen Aminen, wie beispielsweise Triethylammonium-, Dicyclohexylammonium-, *N,N'*-Dibenzylethylen-diammonium-, Pyridinium-, Picolinium- oder Ethanolammoniumsalze, Salze mit anorganischen Säuren (z.B. Hydrochloride, Hydrobromide, Dihydrosulfate, Trihydrosulfate, oder Phosphate), Salze mit organischen Carbonsäuren oder organischen Sulfosäuren (z.B. Formiate, Acetate, Trifluoracetate, Maleate, Tartrate, Methansulfonate, Benzolsulfonate oder 4-Toluolsulfonate). Bekannterweise können t-Amine, wie beispielsweise manche der erfindungsgemäßen Verbindungen, *N*-Oxide bilden, welche ebenfalls erfindungsgemäße Salze darstellen.

**[0067]** Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in Abhängigkeit von der Art der Substituenten als geometrische und/oder als optisch aktive Isomere oder entsprechende Isomerengemische in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen. Diese Stereoisomere sind beispielsweise Enantiomere, Diastereomere, Atropisomere oder geometrische Isomere. Die Erfindung umfasst somit reine Stereoisomere als auch beliebige Gemische dieser Isomere.

**[0068]** Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in verschiedenen polymorphen Formen oder als Mischung verschiedener polymorpher Formen vorliegen. Sowohl die reinen Polymorphe als auch die Polymorphgemische sind Gegenstand der Erfindung und können erfindungsgemäß verwendet werden.

**[0069]** Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können mit anderen insektiziden, nematiziden akariziden oder antimikrobiellen Wirkstoffen gemischt oder gemeinsam angewendet werden. In diesen Mischungen oder gemeinsamen Anwendungen treten synergistische Wirkungen auf, d.h. die beobachtete Wirkung dieser Mischungen oder gemeinsamen Anwendungen ist höher als die Summe der Wirkungen der Einzelwirkstoffe innerhalb dieser Anwendungen. Beispiele für solche Misch- bzw. Kombinationspartner sind:

(1) Acetylcholinesterase (AChE) Inhibitoren, wie beispielsweise Carbamate, z.B. Alanycarb, Aldicarb, Bendiocarb, Benfuracarb, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Ethiofencarb, Fenobucarb, Formetanate, Furathiocarb, Isoprocarb, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Oxamyl, Pirimicarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, Triazamate, Trimethacarb, XMC und Xylylcarb; oder Organophosphate, z.B. Acephate, Azamethiphos, Azinphos-ethyl, Azinphos-methyl, Cadusafos, Chlorethoxyfos, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos-methyl, Coumaphos, Cyanophos, Demeton-S-methyl, Diazinon, Dichlorvos/DDVP, Dicrotophos, Dimethoate, Dimethylvinphos, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Famphur, Fenamiphos, Fenitrothion, Fenthion, Fosthiazate, Heptenophos, Imicyafos, Isofenphos, Isopropyl O-(methoxyaminothio-phosphoryl) salicylat, Isoxathion, Malathion, Mecarbam, Methamidophos, Methidathion, Mevinphos, Monocrotophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton-methyl, Parathion, Parathion-methyl, Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimiphos-methyl, Profenofos, Propetamphos, Prothiofos, Pyraclofos, Pyridaphenthion, Quinalphos, Sulfotep, Tebupirimfos, Temephos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thiometon, Triazophos, Trichlorfon und Vamidothion.

(2) GABA-gesteuerte Chlorid-Kanal-Antagonisten, wie beispielsweise Cyclodien-organochlorine, z.B. Chlordane und Endosulfan; oder Phenylpyrazole (Fiprole), z.B. Ethiprole und Fipronil.

(3) Natrium-Kanal-Modulatoren / Spannungsabhängige Natrium-Kanal-Blocker, wie beispielsweise Pyrethroide, z.B. Acrinathrin, Allethrin, d-cis-trans Allethrin, d-trans Allethrin, Bifenthrin, Bioallethrin, Bioallethrin S-cyclopentenyl Isomer, Bioresmethrin, Cycloprothrin, Cyfluthrin, beta-Cyfluthrin, Cyhalothrin, lambda-Cyhalothrin, gamma-Cyhalothrin, Cypermethrin, alpha-Cypermethrin, beta-Cypermethrin, theta-Cypermethrin, zeta-Cypermethrin, Cyphenothrin [(1R)-trans-Isomere], Deltamethrin, Empenthrin [(EZ)-(1R)-Isomere], Esfenvalerate, Etofenprox, Fenpropathrin, Fenvalerate, Flucythrinate, Flumethrin, tau-Fluvalinate, Halfenprox, Imiprothrin, Kadethrin, Permethrin, Phenothrin [(1R)-trans-Isomere], Prallethrin, Pyrethrine (pyrethrum), Resmethrin, Silafluofen, Tefluthrin, Tetramethrin, Tetramethrin [(1R)-Isomere]], Tralomethrin und Transfluthrin; oder DDT; oder Methoxychlor.

(4) Nikotinerge Acetylcholin-Rezeptor (nAChR) Agonisten, wie beispielsweise Neonikotinoide, z.B. Acetamiprid, Clothianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpyram, Thiacloprid und Thiamethoxam; oder

## EP 2 953 942 B1

Nikotin; oder  
Sulfoxaflor.

- 5 (5) Nikotinerge Acetylcholin-Rezeptor (nAChR) allosterische Aktivatoren, wie beispielsweise Spinosine, z.B. Spinetoram und Spinosad.
- (6) Chlorid-Kanal-Aktivatoren, wie beispielsweise Avermectine/Milbemycine, z.B. Abamectin, Emamectin-benzoat, Lepimectin und Milbemectin.
- 10 (7) Juvenilhormon-Imitatoren, wie beispielsweise Juvenilhormon-Analoga, z.B. Hydroprene, Kinoprene und Methoprene; oder Fenoxycarb; oder Pyriproxyfen.
- (8) Wirkstoffe mit unbekanntem oder nicht spezifischen Wirkmechanismen, wie beispielsweise Alkylhalide, z.B. 15 Methylbromid und andere Alkylhalide; oder Chloropicrin; oder Sulfurylfluorid; oder Borax; oder Brechweinstein.
- (9) Selektive Fraßhemmer, z.B. Pymetrozine; oder Flonicamid.
- 20 (10) Milbenwachstumshemmer, z.B. Clofentezine, Hexythiazox und Diflovidazin; oder Etoxazole.
- (11) Mikrobielle Disruptoren der Insekten Darmmembran, z.B. *Bacillus thuringiensis* Subspezies *israelensis*, *Bacillus* 25 *thuringiensis* Subspezies *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* Subspezies *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* Subspezies *tenebrionis* und *B.t.* Pflanzenproteine: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34 Ab1/35Ab1; oder *Bacillus sphaericus*.
- (12) Inhibitoren der oxidativen Phosphorylierung, ATP-Disruptoren, wie beispielsweise Diafenthion; oder 30 Organozinnverbindungen, z.B. Azocyclotin, Cyhexatin und Fenbutatin-oxid; oder Propargite; oder Tetradifon.
- (13) Entkoppler der oxidativen Phosphorylierung durch Unterbrechung des H-Protongradienten, wie beispielsweise 35 Chlorfenapyr, DNOC und Sulfluramid.
- (14) Nikotinerge Acetylcholin-Rezeptor-Antagonisten, wie beispielsweise Bensultap, Cartap-hydrochlorid, Thiocyclam und Thiosultap-Natrium.
- (15) Inhibitoren der Chitinbiosynthese, Typ 0, wie beispielsweise Bistrifluron, Chlorfluazuron, Diflubenzuron, Flucy- 40 cloxuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Noviflumuron, Teflubenzuron und Triflumuron.
- (16) Inhibitoren der Chitinbiosynthese, Typ 1, wie beispielsweise Buprofezin.
- (17) Häutungstörende Wirkstoffe, Dipteran, wie beispielsweise Cyromazine.
- 45 (18) Ecdyson-Rezeptor Agonisten, wie beispielsweise Chromafenozide, Halofenozide, Methoxyfenozide und Tebufenozide.
- (19) Oktopaminerge Agonisten, wie beispielsweise Amitraz.
- 50 (20) Komplex-III-Elektronentransportinhibitoren, wie beispielsweise Hydramethylnon; oder Acequinocyl; oder Fluacrypyrim.
- (21) Komplex-I-Elektronentransportinhibitoren, beispielsweise 55 METI-Akarizide, z.B. Fenazaquin, Fenpyroximate, Pyrimidifen, Pyridaben, Tebufenpyrad und Tolfenpyrad; oder Rotenone (Derris).
- (22) Spannungsabhängige Natriumkanal-Blocker, z.B. Indoxacarb; oder Metaflumizone.

(23) Inhibitoren der Acetyl-CoA-Carboxylase, wie beispielsweise Tetron- und Tetramsäurederivate, z.B. Spirodiclofen, Spiromesifen und Spirotetramat.

(24) Komplex-IV-Elektronentransportinhibitoren, wie beispielsweise Phosphine, z.B. Aluminiumphosphid, Calciumphosphid, Phosphin und Zinkphosphid; oder Cyanid.

(25) Komplex-II-Elektronentransportinhibitoren, wie beispielsweise Cyenopyrafen und Cyflumetofen.

(28) Ryanodinrezeptor-Effektoren, wie beispielsweise Diamide, z.B. Chlorantraniliprole, Cyantraniliprole und Flubendiamide.

**[0070]** Weitere Wirkstoffe mit unbekanntem Wirkmechanismus, wie beispielsweise Amidoflumet, Azadirachtin, Benclotiaz, Benzoximate, Bifenazate, Bromopropylate, Chinomethionat, Cryolite, Dicofol, Diflovidazin, Fluensulfone, Flufenerim, Flufiprole, Fluopyram, Fufenozide, Imidaclothiz, Iprodione, Meperfluthrin, Pyridalyl, Pyrifluquinazon, Tetrathylfluthrin und Iodmethan; desweiteren Präparate auf Basis von Bacillus firmus (insbesondere Stamm CNCM I-1582, beispielsweise VOTiVO™, BioNem) sowie folgende bekannte wirksame Verbindungen:

3-Brom-N-{2-brom-4-chlor-6-[(1-cyclopropylethyl)carbamoyl]phenyl}-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-carboxamid (bekannt aus WO2005/077934), 4-[[6-Brompyrid-3-yl)methyl](2-fluorethyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus WO2007/115644), 4-[[6-Fluorpyrid-3-yl)methyl](2,2-difluorethyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus WO2007/115644), 4-[[2-Chlor-1,3-thiazol-5-yl)methyl](2-fluorethyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus WO2007/115644), 4-[[6-Chlorpyrid-3-yl)methyl](2-fluorethyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus WO2007/115644), Flupyradifurone, 4-[[6-Chlor-5-fluorpyrid-3-yl)methyl](methyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus WO2007/115643), 4-[[5,6-Dichlorpyrid-3-yl)methyl](2-fluorethyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus WO2007/115646), 4-[[6-Chlor-5-fluorpyrid-3-yl)methyl](cyclopropyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus WO2007/115643), 4-[[6-Chlorpyrid-3-yl)methyl](cyclopropyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus EP-A-0 539 588), 4-[[6-Chlorpyrid-3-yl)methyl](methyl)amino]furan-2(5H)-on (bekannt aus EP-A-0 539 588), {[1-(6-Chlorpyridin-3-yl)ethyl](methyl)oxido- $\lambda^4$ -sulfanyliden}cyanamid (bekannt aus WO2007/149134) und seine Diastereomere {[1-(6-Chlorpyridin-3-yl)ethyl](methyl)oxido- $\lambda^4$ -sulfanyliden}cyanamid (A) und {[1-(6-Chlorpyridin-3-yl)ethyl](methyl)oxido- $\lambda^4$ -sulfanyliden}cyanamid (B) (ebenfalls bekannt aus WO2007/149134) sowie Diastereomere [(R)-Methyl(oxido){1-(6-(trifluormethyl)pyridin-3-yl)ethyl}- $\lambda^4$ -sulfanyliden]cyanamid (A1) und [(S)-Methyl(oxido){1-(6-(trifluormethyl)pyridin-3-yl)ethyl}- $\lambda^4$ -sulfanyliden]cyanamid (A2), bezeichnet als Diastereomerengruppe A (bekannt aus WO 2010/074747, WO 2010/074751), [(R)-Methyl(oxido){1-(6-(trifluormethyl)pyridin-3-yl)ethyl}- $\lambda^4$ -sulfanyliden]cyanamid (B1) und [(S)-Methyl(oxido){1-(6-(trifluormethyl)pyridin-3-yl)ethyl}- $\lambda^4$ -sulfanyliden]cyanamid (B2), bezeichnet als Diastereomerengruppe B (ebenfalls bekannt aus WO 2010/074747, WO 2010/074751) und 11-(4-Chlor-2,6-dimethylphenyl)-12-hydroxy-1,4-dioxa-9-azadispiro[4.2.4.2]tetradec-11-en-10-on (bekannt aus WO2006/089633), 3-(4'-Fluor-2,4-dimethylbiphenyl-3-yl)-4-hydroxy-8-oxa-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (bekannt aus WO2008/067911), 1-{2-Fluor-4-methyl-5-[(2,2,2-trifluorethyl)sulfinyl]phenyl}-3-(trifluormethyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (bekannt aus WO2006/043635), Afidopyropen (bekannt aus WO2008/066153), 2-Cyan-3-(difluormethoxy)-N,N-dimethylbenzolsulfonamid (bekannt aus WO2006/056433), 2-Cyan-3-(difluormethoxy)-N-methylbenzolsulfonamid (bekannt aus WO2006/100288), 2-Cyan-3-(difluormethoxy)-N-ethylbenzolsulfonamid (bekannt aus WO2005/035486), 4-(Difluormethoxy)-N-ethyl-N-methyl-1,2-benzothiazol-3-amin-1,1-dioxid (bekannt aus WO2007/057407), N-[1-(2,3-Dimethylphenyl)-2-(3,5-dimethylphenyl)ethyl]-4,5-dihydro-1,3-thiazol-2-amin (bekannt aus WO2008/104503), {1'-[(2E)-3-(4-Chlorphenyl)prop-2-en-1-yl]-5-fluorspiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-chlorpyridin-4-yl)methanon (bekannt aus WO2003/106457), 3-(2,5-Dimethylphenyl)-4-hydroxy-8-methoxy-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (bekannt aus WO2009/049851), 3-(2,5-Dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-ethylcarbonat (bekannt aus WO2009/049851), 4-(But-2-in-1-yloxy)-6-(3,5-dimethylpiperidin-1-yl)-5-fluorpyrimidin (bekannt aus WO2004/099160), (2,2,3,3,4,4,5,5-Octafluorpentyl)(3,3,3-trifluorpropyl)malononitril (bekannt aus WO2005/063094), (2,2,3,3,4,4,5,5-Octafluorpentyl)(3,3,4,4,4-pentafluorbutyl)malononitril (bekannt aus WO2005/063094), 8-[2-(Cyclopropylmethoxy)-4-(trifluormethyl)phenoxy]-3-[6-(trifluormethyl)pyridazin-3-yl]-3-azabicyclo[3.2.1]octan (bekannt aus WO2007/040280), Flometoquin, PF 1364 (CAS-Reg.Nr. 1204776-60-2) (bekannt aus JP2010/018586), 5-[5-(3,5-Dichlorphenyl)-5-(trifluormethyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)benzonitril (bekannt aus WO2007/075459), 5-[5-(2-Chlorpyridin-4-yl)-5-(trifluormethyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)benzonitril (bekannt aus WO2007/075459), 4-[5-(3,5-Dichlorphenyl)-5-(trifluormethyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-methyl-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluorethyl)amino]ethyl}benzamid (bekannt aus WO2005/085216), 4-[[6-Chlorpyridin-3-yl)methyl](cyclopropyl)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-on, 4-[[6-Chlorpyridin-3-yl)methyl](2,2-difluorethyl)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-on, 4-[[6-Chlorpyridin-3-yl)me-

thyl](ethyl)amino)-1,3-oxazol-2(5H)-on, 4-[[6-Chlorpyridin-3-yl)methyl](methyl)amino)-1,3-oxazol-2(5H)-on (alle bekannt aus WO2010/005692), Pyflubumide (bekannt aus WO2002/096882), Methyl-2-[2-({[3-brom-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-5-chlor-3-methylbenzoyl]-2-methylhydrazincarboxylat (bekannt aus WO2005/085216), Methyl-2-[2-({[3-brom-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-5-cyan-3-methylbenzoyl]-2-ethylhydrazincarboxylat (bekannt aus WO2005/085216), Methyl-2-[2-({[3-brom-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-5-cyan-3-methylbenzoyl]-2-methylhydrazincarboxylat (bekannt aus WO2005/085216), Methyl-2-[3,5-dibrom-2-({[3-brom-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)benzoyl]-1,2-diethylhydrazincarboxylat (bekannt aus WO2005/085216), Methyl-2-[3,5-dibrom-2-({[3-brom-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)benzoyl]-2-ethylhydrazincarboxylat (bekannt aus WO2005/085216), (5RS,7RS;5RS,7SR)-1-(6-Chlor-3-pyridylmethyl)-1,2,3,5,6,7-hexahydro-7-methyl-8-nitro-5-propoxyimidazo[1,2-a]pyridin (bekannt aus WO2007/101369), 2-[6-[2-(5-Fluorpyridin-3-yl)-1,3-thiazol-5-yl]pyridin-2-yl]pyrimidin (bekannt aus WO2010/006713), 2-[6-[2-(5-Fluorpyridin-3-yl)-1,3-thiazol-5-yl]pyridin-2-yl]pyrimidin (bekannt aus WO2010/006713), 1-(3-Chlorpyridin-2-yl)-N-[4-cyan-2-methyl-6-(methylcarbamoyl)phenyl]-3-[[5-(triuormethyl)-1H-tetrazol-1-yl]methyl]-1H-pyrazol-5-carboxamid (bekannt aus WO2010/069502), 1-(3-Chlorpyridin-2-yl)-N-[4-cyan-2-methyl-6-(methylcarbamoyl)phenyl]-3-[[5-(triuormethyl)-2H-tetrazol-2-yl]methyl]-1H-pyrazol-5-carboxamid (bekannt aus WO2010/069502), N-[2-(tert-Butylcarbamoyl)-4-cyan-6-methylphenyl]-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-3-[[5-(trifluormethyl)-1H-tetrazol-1-yl]methyl]-1H-pyrazol-5-carboxamid (bekannt aus WO2010/069502), N-[2-(tert-Butylcarbamoyl)-4-cyan-6-methylphenyl]-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-3-[[5-(trifluormethyl)-2H-tetrazol-2-yl]methyl]-1H-pyrazol-5-carboxamid (bekannt aus WO2010/069502), (1E)-N-[(6-Chlorpyridin-3-yl)methyl]-N'-cyan-N-(2,2-difluorethyl)ethanimidamid (bekannt aus WO2008/009360), N-[2-(5-Amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-chlor-6-methylphenyl]-3-brom-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-carboxamid (bekannt aus CN102057925), Methyl-2-[3,5-dibrom-2-({[3-brom-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)benzoyl]-2-ethyl-1-methylhydrazincarboxylat (bekannt aus WO2011/049233), Heptafluthrin, Pyriminostrobin, Flufenoxystrobin und 3-Chlor-N<sup>2</sup>-(2-cyanpropan-2-yl)-N<sup>1</sup>-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluorpropan-2-yl)-2-methylphenyl]phthalamid (bekannt aus WO2012/034472).

**[0071]** Antimikrobiell wirkende Verbindungen:

(1) Inhibitoren der Ergosterol-Biosynthese, wie beispielsweise Aldimorph, Azaconazol, Bitertanol, Bromuconazol, Cyproconazol, Diclobutrazol, Difenoconazol, Diniconazol, Diniconazol-M, Dodemorph, Dodemorph Acetat, Epoconazol, Etaconazol, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenhexamid, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flutriafol, Furconazol, Furconazol-Cis, Hexaconazol, Imazalil, Imazalil Sulfat, Imibenconazol, Ipconazol, Metconazol, Myclobutanil, Naftifin, Nuarimol, Oxpoconazol, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Peralin, Prochloraz, Propiconazol, Prothioconazol, Pyributicarb, Pyrifenox, Quinconazol, Simeconazol, Spiroxamin, Tebuconazol, Terbinafin, Tetraconazol, Triadimefon, Triadimenol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol, Uniconazol-p, Viniconazol, Voriconazol, 1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)cycloheptanol, Methyl-1-(2,2-dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat, N'-[5-(Difluormethyl)-2-methyl-4-[3-(trimethylsilyl)propoxy]phenyl]-N-ethyl-N-methylimidiformamid, N-Ethyl-N-methyl-N'-[2-methyl-5-(trifluormethyl)-4-[3-(trimethylsilyl)propoxy]phenyl]imidiformamid und O-[1-(4-Methoxyphenoxy)-3,3-dimethylbutan-2-yl]-1H-imidazol-1-carbothioat.

(2) Inhibitoren der Respiration (Atmungsketten-Inhibitoren), wie beispielsweise Bixafen, Boscalid, Carboxin, Diflufmetorim, Fenfuram, Fluopyram, Flutolanil, Fluxapyroxad, Furametpyr, Furmecycloz, Isopyrazam Mischung des synepimeren Razemates 1RS,4SR,9RS und des anti-empimeren Razemates 1RS,4SR,9SR, Isopyrazam (anti-epimeres Razemat), Isopyrazam (anti-epimeres Enantiomer 1R,4S,9S), Isopyrazam (anti-epimeres Enantiomer 1S,4R,9R), Isopyrazam (syn-epimeres Razemat 1RS,4SR,9RS), Isopyrazam (syn-epimeres Enantiomer 1R,4S,9R), Isopyrazam (syn-epimeres Enantiomer 1S,4R,9S), Mepronil, Oxycarboxin, Penflufen, Penthiopyrad, Sedaxane, Thifluzamid, 1-Methyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluorethoxy)phenyl]-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid, 3-(Difluormethyl)-1-methyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluorethoxy)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid, 3-(Difluormethyl)-N-[4-fluor-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluorpropoxy)phenyl]-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamid und N-[1-(2,4-Dichlorphenyl)-1-methoxypropan-2-yl]-3-(difluormethyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamid.

(3) Inhibitoren der Respiration (Atmungsketten-Inhibitoren) am Komplex III der Atmungskette, wie beispielsweise Ametocradin, Amisulbrom, Azoxystrobin, Cyazofamid, Dimoxystrobin, Enestroburin, Famoxadon, Fenamidon, Fluoxastrobin, Kresoxim-Methyl, Metominostrobin, Orystrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin, Pyrametostrobin, Pyraoxystrobin, Pyribencarb, Trifloxystrobin, (2E)-2-(2-[[6-(3-Chlor-2-methylphenoxy)-5-fluorpyrimidin-4-yl]oxy]phenyl)-2-(methoxyimino)-N-methyl-ethanamid, (2E)-2-(Methoxyimino)-N-methyl-2-(2-[[1-(3-(trifluormethyl)phenyl]ethylidene)amino]oxy]methyl)phenyl)ethanamid, (2E)-2-(Methoxyimino)-N-methyl-2-(2-[[1-(3-(trifluormethyl)phenyl]ethoxy]imino)methyl]phenyl)ethanamid, (2E)-2-[2-[[1-(3-[[1-(3-Fluor-2-phenylethenyl)oxy]phe-

nyl)ethyliden]amino)oxy)methyl]phenyl)-2-(methoxyimino)-N-methylethan-amid, (2E)-2-{2-[[{(2E,3E)-4-(2,6-Di-chlorphenyl)but-3-en-2-yliden]amino)oxy)methyl]phenyl)-2-(methoxyimino)-N-methylethanamid, 2-Chlor-N-(1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)pyridin-3-carboxamid, 5-Methoxy-2-methyl-4-(2-[[{(1E)-1-[3-(trifluormethyl)phenyl]ethyliden]amino)oxy)methyl]phenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on, Methyl-(2E)-2-{2-[[{(cyclopropyl[(4-methoxyphenyl)imino]methyl)sulfanyl)methyl]phenyl)-3-methoxyprop-2-enoat, N-(3-Ethyl-3,5,5-trimethylcyclohexyl)-3-(formylamino)-2-hydroxybenzamid, 2-{2-[[{(2,5-Dimethylphenoxy)methyl]phenyl)-2-methoxy-N-methylacetamid und (2R)-2-{2-[[{(2,5-Dimethylphenoxy)methyl]phenyl)-2-methoxy-N-methylacetamid.

(4) Inhibitoren der Mitose und Zellteilung, wie beispielsweise Benomyl, Carbendazim, Chlorfenazol, Diethofencarb, Ethaboxam, Fluopicolid, Fuberidazol, Pencycuron, Thiabendazol, Thiophanat-Methyl, Thiophanat, Zoxamid, 5-Chlor-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin und 3-Chlor-5-(6-chlorpyridin-3-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorphenyl)pyridazin.

(5) Verbindungen mit Multisite-Aktivität, wie beispielsweise Bordeauxmischung, Captafol, Captan, Chlorothalonil, Kupferzubereitungen wie Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxid, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Dichloflu-anid, Dithianon, Dodine, Dodine freie Base, Ferbam, Fluorofolpet, Folpet, Guazatin, Guazatinacetat, Iminoctadin, Iminoctadinalbesilat, Iminoctadinriacetat, Mankupfer, Mancozeb, Maneb, Metiram, Zinkmetiram, Kupfer-Oxin, Propamidin, Propineb, Schwefel und Schwefelzubereitungen wie beispielsweise Calciumpolysulfid, Thiram, Tolyflua-nid, Zineb und Ziram.

(6) Resistenzinduktoren, wie beispielsweise Acibenzolar-S-Methyl, Isotianil, Probenazol und Tiadinil.

(7) Inhibitoren der Aminosäure- und Protein-Biosynthese, wie beispielsweise Andoprim, Blasticidin-S, Cyprodinil, Kasugamycin, Kasugamycin Hydrochlorid Hydrat, Mepanipyrin und Pyrimethanil.

(8) Inhibitoren der ATP Produktion, wie beispielsweise Fentin Acetat, Fentin Chlorid, Fentin Hydroxid und Silthiofam.

(9) Inhibitoren der Zellwandsynthese, wie beispielsweise Benthiavalicarb, Dimethomorph, Flumorph, Iprovalicarb, Mandipropamid, Polyoxins, Polyoxorim, Validamycin A und Valifenalat.

(10) Inhibitoren der Lipid- und Membran-Synthese, wie beispielsweise Biphenyl, Chloroneb, Dicloran, Edifenphos, Etridiazol, Iodocarb, Iprobenfos, Isoprothiolan, Propamocarb, Propamocarb Hydrochlorid, Prothiocarb, Pyrazophos, Quintozen, Tecnazene und Tolclofos-Methyl.

(11) Inhibitoren der Melanin-Biosynthese, wie beispielsweise Carpropamid, Diclocymet, Fenoxanil, Fthalid, Pyro-quilon und Tricyclazol.

(12) Inhibitoren der Nukleinsäuresynthese, wie beispielsweise Benalaxyl, Benalaxyl-M (Kiralaxyl), Bupirimat, Clozylacon, Dimethirimol, Ethirimol, Furalaxyl, Hymexazol, Metalaxyl, Metalaxyl-M (Mefenoxam), Ofurace, Oxadixyl, Oxolinsäure.

(13) Inhibitoren der Signaltransduktion, wie beispielsweise Chlozolinat, Fenciclonil, Fludioxonil, Iprodion, Procymi-don, Quinoxifen und Vinclozolin.

(14) Entkoppler, wie beispielsweise Binapacryl, Dinocap, Ferimzon, Fluazinam und Meptyldinocap.

(15) Weitere Verbindungen, wie beispielsweise Benthiazol, Bethoxazin, Capsimycin, Carvon, Chinomethionat, Chlazafenon, Cufraneb, Cyflufenamid, Cymoxanil, Cyprosulfamide, Dazomet, Debacarb, Dichlorophen, Diclomezin, Difenzoquat, Difenzoquat Methylsulphat, Diphenylamin, Ecomat, Fenpyrazamin, Flumetover, Fluoromid, Flusulfamid, Flutianil, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Calcium, Fosetyl-Natrium, Hexachlorbenzol, Irumamycin, Methasulfo-carb, Methylisothiocyanat, Metrafenon, Mildiomycin, Natamycin, Nickel Dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-Isopropyl, Octhilinone, Oxamocarb, Oxyfenthiin, Pentachlorphenol und dessen Salze, Phenothrin, Phosphorsäure und deren Salze, Propamocarb-Fosetyl, Propanosin-Natrium, Proquinazid, Pyrrolnitrin, Tebufloquin, Teclotalam, Tolnifanid, Triazoxid, Trichlamid, Zarilamid, 1-(4-{4-[(SR)-5-(2,6-Difluorphenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}pi-peridin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon, 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-Difluorphenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon, 1-(4-{4-[5-(2,6-Difluorphenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon, 1-(4-Methoxyphenoxy)-3,3-dimethylbutan-2-yl-1H-imidazol-1-carboxylat, 2,3,5,6-

Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)pyridin, 2,3-Dibutyl-6-chlorthieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-on, 2-[5-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(SR)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl})piperidin-1-yl)ethanon, 2-[5-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5S)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl})piperidin-1-yl)ethanon, 2-[5-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-{4-[4-(5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl)-1,3-thiazol-2-yl]}piperidin-1-yl)ethanon, 2-Butoxy-6-iodo-3-propyl-4H-chromen-4-on, 2-Chlor-5-[2-chlor-1-(2,6-difluor-4-methoxyphenyl)-4-methyl-1H-imidazol-5-yl]pyridin, 2-Phenylphenol und dessen Salze, 3,4,5-Trichlorpyridin-2,6-dicarbonitril, 3-[5-(4-Chlorphenyl)-2,3-dimethyl-1,2-oxazolidin-3-yl]pyridin, 3-Chlor-5-(4-chlorphenyl)-4-(2,6-difluorphenyl)-6-methylpyridazin, 4-(4-Chlorphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,6-dimethylpyridazin, 5-Amino-1,3,4-thiadiazol-2-thiol, 5-Chlor-N'-phenyl-N'-(prop-2-in-1-yl)thiophen-2-sulfonohydrazid, 5-Methyl-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amin, Ethyl-(2Z)-3-amino-2-cyano-3-phenylprop-2-enoat, N-(4-Chlorbenzyl)-3-[3-methoxy-4-(prop-2-in-1-yloxy)phenyl]propanamid, N-[(4-Chlorphenyl)(cyan)methyl]-3-[3-methoxy-4-(prop-2-in-1-yloxy)phenyl]propanamid, N-[(5-Brom-3-chlorpyridin-2-yl)methyl]-2,4-dichlorpyridin-3-carboxamid, N-[1-(5-Brom-3-chlorpyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichlorpyridin-3-carboxamid, N-[1-(5-Brom-3-chlorpyridin-2-yl)ethyl]-2-fluor-4-iodopyridin-3-carboxamid, N-[(E)-[(Cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluormethoxy)-2,3-difluorphenyl]methyl]-2-phenylacetamid, N-[(Z)-[(Cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluormethoxy)-2,3-difluorphenyl]methyl]-2-phenylacetamid, N-Methyl-2-(1-[[5-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]acetyl]piperidin-4-yl)-N-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-1,3-thiazol-4-carboxamid, N-Methyl-2-(1-[[5-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]acetyl]piperidin-4-yl)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazol-4-carboxamid, N-Methyl-2-(1-[[5-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-1-yl]acetyl]piperidin-4-yl)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazol-4-carboxamid, Pentyl-6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylidene]amino]oxy]methyl]pyridin-2-yl]carbamate, Phenazin-1-carbonsäure, Chinolin-8-ol und Chinolin-8-olsulfat(2:1).

(16) weitere antimikrobiell wirksame Verbindungen: (15.1) benthiazole, (15.2) bethoxazin, (15.3) capsimycin, (15.4) carvone, (15.5) chinomethionat, (15.6) pyriofenone (chlazafenone), (15.7) cufraneb, (15.8) cyflufenamid, (15.9) cymoxanil, (15.10) cyprosulfamide, (15.11) dazomet, (15.12) debacarb, (15.13) dichlorophen, (15.14) diclomezine, (15.15) difenzoquat, (15.16) difenzoquat metilsulfate, (15.17) diphenylamine, (15.18) ecomate, (15.19) fenpyrazamine, (15.20) flumetover, (15.21) fluoroimide, (15.22) flusulfamide, (15.23) flutianil, (15.24) fosetyl-aluminium, (15.25) fosetyl-calcium, (15.26) fosetyl-sodium, (15.27) hexachlorobenzene, (15.28) irumamycin, (15.29) methasulfocarb, (15.30) methyl isothiocyanate, (15.31) metrafenone, (15.32) mildiomyacin, (15.33) natamycin, (15.34) nickel dimethyldithiocarbamate, (15.35) nitrothal-isopropyl, (15.37) oxamocarb, (15.38) oxyfenthiiin, (15.39) pentachlorophenol and salts, (15.40) phenothrin, (15.41) phosphorous acid and its salts, (15.42) propamocarb-fosetylate, (15.43) propanosine-sodium, (15.44) pyrimorph, (15.45) (2E)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-chloropyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-one, (15.46) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-chloropyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-one, (15.47) pyrrolnitrin, (15.48) tebufloquin, (15.49) tecloftalam, (15.50) tolifenanide, (15.51) triazoxide, (15.52) trichlamide, (15.53) zarilamid, (15.54) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[[3-[(isobutyryloxy)methoxy]-4-methoxypyridin-2-yl]carbonyl]amino]-6-methyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-methylpropanoate, (15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl})piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon, (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl})piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon, (15.57) 1-(4-{4-[5-(2,6-difluorophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl})piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon, (15.58) 1-(4-methoxyphenoxy)-3,3-dimethylbutan-2-yl 1H-imidazole-1-carboxylate, (15.59) 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulfonyl)pyridine, (15.60) 2,3-dibutyl-6-chlorothieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-one, (15.61) 2,6-dimethyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrrole-1,3,5,7(2H,6H)-tetrone, (15.62) 2-[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5R)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl})piperidin-1-yl)ethanon, (15.63) 2-[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5S)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl})piperidin-1-yl)ethanon, (15.64) 2-[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-{4-[4-(5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl)-1,3-thiazol-2-yl]}piperidin-1-yl)ethanon, (15.65) 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4H-chromen-4-one, (15.66) 2-chloro-5-[2-chloro-1-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-4-methyl-1H-imidazol-5-yl]pyridine, (15.67) 2-phenylphenol and salts, (15.68) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisouquinolin-1-yl)quinoline, (15.69) 3,4,5-trichloropyridine-2,6-dicarbonitril, (15.70) 3-chloro-5-(4-chlorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-6-methylpyridazine, (15.71) 4-(4-chlorophenyl)-5-(2,6-difluorophenyl)-3,6-dimethylpyridazine, (15.72) 5-amino-1,3,4-thiadiazole-2-thiol, (15.73) 5-chloro-N'-phenyl-N'-(prop-2-yn-1-yl)thiophene-2-sulfonohydrazide, (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amine, (15.75) 5-fluoro-2-[(4-methylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amine, (15.76) 5-methyl-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, (15.77) ethyl (2Z)-3-amino-2-cyano-3-phenylacrylate, (15.78) N'-(4-[[3-(4-chlorobenzyl)-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy]-2,5-dimethylphenyl)-N-ethyl-N-methylimidiformamide, (15.79) N-(4-chlorobenzyl)-3-[3-methoxy-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamide, (15.80) N-[(4-chlorophenyl)(cyano)methyl]-3-[3-methoxy-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamide, (15.81) N-[(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)methyl]-2,4-dichloronicotinamide, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichloronicotinamide, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-

2-yl)ethyl]-2-fluoro-4-iodonicotinamide, (15.84) N-((E)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl)-2-phenylacetamide, (15.85) N-((Z)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl)-2-phenylacetamide, (15.86) N'-[4-[(3-tert-butyl-4-cyano-1,2-thiazol-5-yl)oxy]-2-chloro-5-methylphenyl]-N-ethyl-N-methylimidiformamide, (15.87) N-methyl-2-(1-[[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]acetyl]piperidin-4-yl)-N-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-1,3-thiazole-4-carboxamide, (15.88) N-methyl-2-(1-[[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]acetyl]piperidin-4-yl)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazole-4-carboxamide, (15.89) N-methyl-2-(1-[[5-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]acetyl]piperidin-4-yl)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazole-4-carboxamide, (15.90) pentyl {6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy]methyl}pyridin-2-yl}carbamate, (15.91) phenazine-1-carboxylic acid, (15.92) quinolin-8-ol, (15.93) quinolin-8-ol sulfate (2:1), (15.94) tert-butyl {6-[[[(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy]methyl}pyridin-2-yl}carbamate, (15.95) 1-methyl-3-(trifluoromethyl)-N-[2'-(trifluoromethyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.96) N-(4'-chlorobiphenyl-2-yl)-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.97) N-(2',4'-dichlorobiphenyl-2-yl)-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.98) 3-(difluoromethyl)-1-methyl-N-[4'-(trifluoromethyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.99) N-(2',5'-difluorobiphenyl-2-yl)-1-methyl-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.100) 3-(difluoromethyl)-1-methyl-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.101) 5-fluoro-1,3-dimethyl-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.102) 2-chloro-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamide, (15.103) 3-(difluoromethyl)-N-[4'-(3,3-dimethylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.104) N-[4'-(3,3-dimethylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.105) 3-(difluoromethyl)-N-(4'-ethynylbiphenyl-2-yl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.106) N-(4'-ethynylbiphenyl-2-yl)-5-fluoro-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.107) 2-chloro-N-(4'-ethynylbiphenyl-2-yl)nicotinamide, (15.108) 2-chloro-N-[4'-(3,3-dimethylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamide, (15.109) 4-(difluoromethyl)-2-methyl-N-[4'-(trifluoromethyl)biphenyl-2-yl]-1,3-thiazole-5-carboxamide, (15.110) 5-fluoro-N-[4'-(3-hydroxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.111) 2-chloro-N-[4'-(3-hydroxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamide, (15.112) 3-(difluoromethyl)-N-[4'-(3-methoxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.113) 5-fluoro-N-[4'-(3-methoxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.114) 2-chloro-N-[4'-(3-methoxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamide, (15.115) (5-bromo-2-methoxy-4-methylpyridin-3-yl)(2,3,4-trimethoxy-6-methylphenyl)methanone, (15.116) N-[2-(4-[[3-(4-chlorophenyl)prop-2-yn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl)ethyl]-N2-(methylsulfonyl)valinamide, (15.117) 4-oxo-4-[(2-phenylethyl)amino]butanoic acid, (15.118) but-3-yn-1-yl{6-[[[(Z)-(1-methyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)methylene]amino]oxy]methyl}pyridin-2-yl}carbamate, (15.119) 4-amino-5-fluoropyrimidin-2-ol (mesomeric form: 4-amino-5-fluoropyrimidin-2(1H)-one), (15.120) propyl 3,4,5-trihydroxybenzoate, (15.121) 1,3-dimethyl-N-(1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.122) 1,3-dimethyl-N-[(3R)-1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.123) 1,3-dimethyl-N-[(3S)-1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.124) [3-(4-chloro-2-fluorophenyl)-5-(2,4-difluorophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)methanol, (15.125) (S)-[3-(4-chloro-2-fluorophenyl)-5-(2,4-difluorophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)methanol, (15.126) (R)-[3-(4-chloro-2-fluorophenyl)-5-(2,4-difluorophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)methanol, (15.127) 2-[[[3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.128) 1-[[[3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-1H-1,2,4-triazol-5-yl]thiocyanate, (15.129) 5-(allylsulfanyl)-1-[[[3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-1H-1,2,4-triazole, (15.130) 2-[1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.131) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.132) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.133) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-1H-1,2,4-triazol-5-yl]thiocyanate, (15.134) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-1H-1,2,4-triazol-5-yl]thiocyanate, (15.135) 5-(allylsulfanyl)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-1H-1,2,4-triazole, (15.136) 5-(allylsulfanyl)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-chlorophenyl)-2-(2,4-difluorophenyl)oxiran-2-yl]methyl]-1H-1,2,4-triazole, (15.137) 2-[(2S,4S,SS)-1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.139) 2-[(2R,4R,SR)-1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.140) 2-[(2S,4R,SR)-1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.141) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.143) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-dichlorophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (15.145) 2-fluoro-6-(trifluoromethyl)-N-(1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamide, (15.146) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazoline,

## EP 2 953 942 B1

(15.147) 2-[6-(3-fluoro-4-methoxyphenyl)-5-methylpyridin-2-yl]quinazoline, (15.148) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinoline, (15.149) Abscisic acid.

**[0072]** Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner mit Mikroorganismen kombiniert werden.

**[0073]** Die Mikroorganismen eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit, günstiger Warmblütertoxizität und guter Umweltverträglichkeit zum Schutz von Pflanzen und Pflanzenorganen, zur Steigerung der Ernteerträge, Verbesserung der Qualität des Erntegutes und zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren, Helminthen, Nematoden und Mollusken, die in der Landwirtschaft, im Gartenbau, bei der Tierzucht, in Forsten, in Gärten und Freizeiteinrichtungen, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Mikroorganismen gehören:

Mikroorganismen aus der Gruppe der Bakterien, z.B. *Bacillus agri*, *Bacillus aizawai*, *Bacillus albolactis*, *Bacillus amyloliquefaciens*, insbesondere der Stamm B. *amyloliquefaciens* IN937a, oder Stamm FZB42, *Bacillus cereus*, insbesondere Sporen von B. *cereus* CNCM 1-1562, *Bacillus coagulans*, *Bacillus endoparasiticus*, *Bacillus endorhythmos*, *Bacillus firmus*, insbesondere Sporen von B. *firmus* CNCM I-1582, *Bacillus kurstaki*, *Bacillus lacticola*, *Bacillus lactimorbus*, *Bacillus lactis*, *Bacillus laterosporus*, *Bacillus lentimorbus*, *Bacillus licheniformis*, *Bacillus medusa*, *Bacillus megaterium*, *Bacillus metiens*, *Bacillus natto*, *Bacillus nigrificans*, *Bacillus popilliae*, *Bacillus pumilus*, insbesondere der Stamm B. *pumilus* GB34, *Bacillus siamensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, insbesondere der Stamm B. *subtilis* GB03, oder der Stamm B. *subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24, *Bacillus thuringiensis*, insbesondere B. *thuringiensis* var. *israelensis* oder B. *thuringiensis* ssp. *aizawai* Stamm ABTS-1857 oder, B. *thuringiensis* ssp. *kurstaki* Stamm HD-1, B. *thuringiensis* var. *san diego*" B. *thuringiensis* var. *tenebrinos*, *Bacillus uniflagellatus*, *Delftia acidovorans*, insbesondere Stamm RAY209, *Lysobacter antibioticus*, insbesondere Stamm 13-1, *Metarhizium anisopliae*, *Pseudomonas chlororaphis*, insbesondere Stamm MA342, *Pseudomonas proradix*, *Streptomyces galbus*, insbesondere Stamm K61, *Streptomyces griseoviridis*;

Mikroorganismen aus der Gruppe der Pilze, z.B. *Ampelomyces quisqualis*, insbesondere Stamm AQ10, *Aureobasidium pullulans*, insbesondere Blastosporen von Stamm DSM14940 oder Blastosporen von Stamm DSM14941 oder Mischungen davon, *Beauveria bassiana*, insbesondere Stamm ATCC74040, *Beauveria brongniartii*, *Candida oleophila*, insbesondere Stamm O, *Coniothyrium minitans*, insbesondere Stamm CON/M/91-8, *Dilophosphora alopecuri*, *Gliocladium catenulatum*, insbesondere Stamm J1446; *Hirsutella thompsonii*, *Lagenidium giganteum*, *Lecanicillium lecanii* (vormals bekannt als *Verticillium lecanii*), insbesondere Konidien von Stamm KV01, *Metarhizium anisopliae*, insbesondere Stamm F52, *Metschnikovia fructicola*, insbesondere Stamm NRRL Y-30752, *Microsphaeropsis ochracea*, *Muscodor albus*, insbesondere Stamm QST20799, *Nomuraea rileyi*, *Paecilomyces lilacinus*, insbesondere Sporen von Stamm P. *lilacinus* 251, *Penicillium bilaii*, insbesondere Stamm ATCC22348, *Pichia anomala*, insbesondere Stamm WRL-076, *Pseudozyma flocculosa*, insbesondere Stamm PF-A22 UL, *Pytium oligandrum* DV74, *Trichoderma asperellum*, insbesondere Stamm ICC012, *Trichoderma harzianum*, insbesondere T. *harzianum* T39, *Verticillium lecanii*, insbesondere die Stämme DAOM198499 und DAOM216596;

insektizide Mikroorganismen aus der Gruppe der Protozoa, z.B. *Nosema locustae*, *Vairimorpha*;

insektizide Mikroorganismen aus der Gruppe der Viren, z.B. Gypsy moth (*Lymantria dispar*) nuclear polyhedrosis virus (NPV), Tussock moth (*Lymantriidae*) NPV, *Heliothis* NPV, Pine sawfly (*Neodiprion*) NPV, Codling moth (*Cydia pomonella*) granulosus virus (GV);

Mikroorganismen aus der Gruppe der entomopathogenen Nematoden, z.B. *Steinernema scapterisci*, *Steinernema feltiae* (*Neoplectana carpocapsae*), *Heterorhabditis heliothidis*, *Xenorhabdus luminescence*.

**[0074]** Die hier mit ihrem "common name" genannten Wirkstoffe sind bekannt und beispielsweise im Pestizidhandbuch ("The Pesticide Manual" 14th Ed., British Crop Protection Council 2006) beschrieben oder im Internet recherchierbar (z.B. <http://www.alanwood.net/pesticides>).

**[0075]** Alle genannten Mischpartner der Klassen (1) bis (16) können, wenn sie auf Grund ihrer funktionellen Gruppen dazu imstande sind, gegebenenfalls mit geeigneten Basen oder Säuren Salze bilden.

**[0076]** Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Verbindungen der Formel (I) sich bei guter Pflanzenverträglichkeit, günstiger Warmblütertoxizität und guter Umweltverträglichkeit vor allem zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Arthropoden, Insekten, Spinnentieren, Helminthen, Nematoden und Mollusken, die in der Landwirtschaft, in den Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor oder im Bereich der Tiergesundheit vorkommen, eignen. Gleichfalls können die erfindungsgemäßen Verbindungen im Bereich der Tiergesundheit verwendet

werden, beispielsweise zur Bekämpfung von Endo- und/oder Ectoparasiten.

**[0077]** Die erfindungsgemäßen Verbindungen können als Mittel zur Bekämpfung tierischer Schädlinge, vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam.

**[0078]** Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in allgemein bekannte Formulierungen überführt werden. Solche Formulierungen enthalten im Allgemeinen von 0,01 bis 98 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise von 0,5 bis 90 Gew.-%.

**[0079]** Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen oder Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

**[0080]** Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,00000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise von 0,00001 bis 1 Gew.-% liegen.

**[0081]** Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

**[0082]** Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbarer oder nicht schützbarer Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Saatgut sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Saatgut.

**[0083]** Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen, Injizieren und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Saatgut, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

**[0084]** Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Die Begriffe "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurden oben erläutert.

**[0085]** Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

**[0086]** Im Bereich Tiergesundheit, d.h. auf dem veterinärmedizinischen Gebiet, wirken die Wirkstoffe gemäß der vorliegenden Erfindung gegen tierische Parasiten, insbesondere Ektoparasiten oder, in einer weiteren Ausführungsform auch Endoparasiten. Der Begriff Endoparasiten schließt insbesondere Helminthen wie Cestoden, Nematoden oder Trematoden, und Protozoen wie Kozzidien ein. Ektoparasiten sind typischerweise und vorzugsweise Arthropoden, insbesondere Insekten wie Fliegen (stechend und leckend), parasitische Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge, Flöhe und dergleichen; oder Akariden wie Zecken, zum Beispiel Schildzecken oder Lederzecken, oder Milben wie Räude milben, Laufmilben, Federmilben und dergleichen sowie aquatische Ektoparasiten wie Copepoden.

**[0087]** Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp.; spezielle Beispiele sind: *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*, *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*;

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen *Amblycerina* und *Ischnocera* z.B. *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; spezielle Beispiele sind: *Bovicola bovis*, *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Damalina bovis*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostratus*, *Bovicola caprae*, *Lepikentron ovis*, *Werneckiella equi*;

## EP 2 953 942 B1

Aus der Ordnung der Diptera und den Unterordnungen Nematocera und Brachycera z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; spezielle Beispiele sind: *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles maculipennis*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Simulium reptans*, *Phlebotomus papatasi*, *Phlebotomus longipalpis*, *Odagmia ornata*, *Wilhelmia equina*, *Boopthora erythrocephala*, *Tabanus bromius*, *Tabanus spodopterus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus sudeticus*, *Hybomitra ciurea*, *Chrysops caecutiens*, *Chrysops relictus*, *Haematopota pluvialis*, *Haematopota italica*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Haematobia irritans irritans*, *Haematobia irritans exigua*, *Haematobia stimulans*, *Hydrotaea irritans*, *Hydrotaea albipuncta*, *Chrysomya chloropyga*, *Chrysomya bezziana*, *Oestrus ovis*, *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Przhevalskiana silenus*, *Dermatobia hominis*, *Melophagus ovinus*, *Lipoptena capreoli*, *Lipoptena cervi*, *Hippobosca variegata*, *Hippobosca equina*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gasterophilus haemorroidalis*, *Gasterophilus inermis*, *Gasterophilus nasalis*, *Gasterophilus nigricornis*, *Gasterophilus pecorum*, *Braula coeca*;

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.; spezielle Beispiele sind: *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. Aus der Ordnung der Blattellida z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp. (z.B. *Supella longipalpa*);

Aus der Unterklasse der Acari (Acarina) und den Ordnungen der Meta- und Mesostigmata z.B. *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Dermanyssus* spp., *Rhipicephalus* spp. (der ursprünglichen Gattung der Mehrwirtszecken), *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; spezielle Beispiele sind: *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *microplus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *decoloratus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *annulatus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *calceratus*, *Hyalomma anatolicum*, *Hyalomma aegypticum*, *Hyalomma marginatum*, *Hyalomma transiens*, *Rhipicephalus evertsi*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes hexagonus*, *Ixodes canisuga*, *Ixodes pilosus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis punctata*, *Haemaphysalis cinnabarina*, *Haemaphysalis otophila*, *Haemaphysalis leachi*, *Haemaphysalis longicornis*, *Dermacentor marginatus*, *Dermacentor reticulatus*, *Dermacentor pictus*, *Dermacentor albipictus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma mauritanicum*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus bursa*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus capensis*, *Rhipicephalus turanicus*, *Rhipicephalus zambeziensis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*, *Amblyomma hebraeum*, *Amblyomma cajennense*, *Dermanyssus gallinae*, *Ornithonyssus bursa*, *Ornithonyssus sylviarum*, *Varroa jacobsoni*;

Aus der Ordnung der Actiniedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.; spezielle Beispiele sind: *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella blakei*, *Demodex canis*, *Demodex bovis*, *Demodex ovis*, *Demodex caprae*, *Demodex equi*, *Demodex caballi*, *Demodex suis*, *Neotrombicula autumnalis*, *Neotrombicula desaleri*, *Nesochöngastia xerothermobia*, *Trombicula akamushi*, *Otodectes cynotis*, *Notoedres cati*, *Sarcoptes canis*, *Sarcoptes bovis*, *Sarcoptes ovis*, *Sarcoptes rupicaprae* (= *S. caprae*), *Sarcoptes equi*, *Sarcoptes suis*, *Psoroptes ovis*, *Psoroptes cuniculi*, *Psoroptes equi*, *Chorioptes bovis*, *Psorergates ovis*, *Pneumonyssoides mange*, *Pneumonyssoides caninum*, *Acarapis woodi*.

**[0088]** Aus Unterklasse der Copepoden mit der Ordnung der Siphonostomatoidea insbesondere die Gattungen *Lepeophtheirus* und *Caligus*, beispielhaft und besonders bevorzugt seien die Arten *Lepeophtheirus salmonis*, *Caligus elongatus* und *Caligus clemensi* genannt

**[0089]** Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, Helminthen und Protozoen, die Tiere befallen. Zu den Tieren zählen landwirtschaftliche Nutztiere wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde,

Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Zuchtfische, Honigbienen. Zu den Tieren zählen außerdem Haustiere - die auch als Heimtiere bezeichnet werden - wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse.

**[0090]** Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden - oder in einer weiteren Ausführungsform auch Helminthen und/oder Protozoen - sollen Todesfälle vermindert und die Leistung (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) und die Gesundheit des Wirtstieres verbessert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

**[0091]** So ist es beispielsweise wünschenswert, die Aufnahme von Blut des Wirts durch die Parasiten (falls zutreffend) zu verhindern oder zu unterbrechen. Eine Bekämpfung der Parasiten kann außerdem dazu beitragen, die Übertragung infektiöser Substanzen zu verhindern.

**[0092]** Der Begriff "Bekämpfung", so wie er hier bezogen auf den Bereich Tiergesundheit verwendet wird, bedeutet, dass die Wirkstoffe wirken, indem sie das Vorkommen des betreffenden Parasiten in einem mit solchen Parasiten befallenen Tier auf unschädliche Niveaus reduzieren. Genauer gesagt bedeutet "Bekämpfung", wie hier verwendet, dass der Wirkstoff den betreffenden Parasiten tötet, sein Wachstum hemmt oder seine Proliferation inhibiert.

**[0093]** Im allgemeinen können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe, wenn sie für die Behandlung von Tieren eingesetzt werden, direkt angewendet werden. Vorzugsweise werden sie als pharmazeutische Zusammensetzungen angewendet, die im Stand der Technik bekannte pharmazeutisch unbedenkliche Exzipienten und/oder Hilfsstoffe enthalten können.

**[0094]** Die Anwendung (= Verabreichung) der Wirkstoffe im Bereich Tiergesundheit und in der Tierhaltung erfolgt in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subkutan, intravenös, intraperitoneal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Applikation in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw. Die Wirkstoffe können als Shampoo oder als geeignete, in Aerosolen oder drucklosen Sprays, z.B. Pumpsprays und Zerstäubersprays, anwendbare, Formulierungen formuliert werden.

**[0095]** Bei der Anwendung für Nutztiere, Geflügel, Haustiere etc. kann man die erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Spritzpulver [wetable powders, "WP"], Emulsionen, Emulsionskonzentrate [emulsifiable concentrates, "EC"], fließfähige Mittel, homogene Lösungen und Suspensionskonzentrate [suspension concentrates, "SC"]), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach Verdünnung (z.B. 100- bis 10 000facher Verdünnung) anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

**[0096]** Beim Einsatz im Bereich Tiergesundheit können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Erweiterung des Wirkungsspektrums in Kombination mit geeigneten Synergisten, Repellentien oder anderen Wirkstoffen wie beispielsweise Akariziden, Insektiziden, Anthelmintika, Mitteln gegen Protozoen, verwendet werden. Potentielle Mischpartner für erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) können bei Anwendungen in der Tiergesundheit eine oder mehrere Verbindungen der Gruppen von Wirkstoffen sein, die bereits auf den Seiten 26 (ab Zeile 9) bis Seite 31 (Zeile 20) aufgeführt wurden. Hierbei eignet sich folgende Auswahl bzw. zusätzlich folgende Wirkstoffe für Verwendung in Mischungen in Anwendungen im Bereich Tiergesundheit besonders:

Aus der Gruppe der Acetylcholinesterase (AChE) Inhibitoren: aus der Gruppe der Carbamate seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Bendiocarb, Carbaryl, Methomyl, Promacyl und Propoxur genannt; oder

aus der Gruppe der Organophosphate seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Azamethiphos, Chlorfenvinphos, Chlorpyrifos, Coumaphos, Cythioate, Diazinon (Dimpylate), Dichlorvos (DDVP), Dicrotophos, Dimethoate, Ethion (Diethion), Famphur (Famophos), Fenitrothion, Fenthion (MPP), Heptenophos, Malathion, Naled, Phosmet (PMP, Phtalofos) Phoxim, Propetamphos, Temephos, Tetrachlorvinphos (CVMP) und Triclorfon/Metrifonate genannt.

**[0097]** Aus der Gruppe der GABA-gesteuerte Chlorid-Kanal-Antagonisten: aus der Gruppe der Organochlorine, seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Endosulphan (alpha-) und Lindan genannt; oder aus der Gruppe der Fiprole (Phenylpyrazole), z. B. Acetoprole, Ethiprole, Fipronil, Pyrafluprole und Pyriprole, Rizazole seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Fipronil und Pyriprole genannt; oder aus der Gruppe der Arylisoxazoline, Arylpyrrolone, Arylpyrrolidine z. B. Fluralaner (bekannt aus WO2009/2024541, Bsp . 11-1; aber auch Verbindungen aus WO2012007426, WO2012042006, WO2012042007, WO2012107533, WO2012120135, WO2012165186, WO2012155676, WO2012017359, WO2012127347, WO2012038851, WO2012120399, WO2012156400, WO2012163959, WO2011161130, WO2011073444, WO2011092287, WO2011075591, WO2011157748, WO 2007/075459, WO 2007/125984, WO 2005/085216, WO 2009/002809), Afoxo-

laner (z.B. in WO2011149749) und strukturell verwandte Arylpyrrolone (bekannt z.B. aus WO2009/072621, WO 2010020522, WO 2009112275, WO 2009097992, WO 2009072621, JP 2008133273, JP 2007091708), oder Arylpyrrolidine (z.B. in WO2012004326, WO2012035011, WO2012045700, WO 2010090344, WO 2010043315, WO 2008128711, JP 2008110971), seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Afoxolaner und Fluralaner genannt.

oder aus der Gruppe der sogenannten Metadiamide (bekannt z.B. aus WO2012020483, WO2012020484, WO2012077221, WO2012069366, WO2012175474, WO2011095462, WO2011113756, WO2011093415, WO2005073165)

**[0098]** Aus der Gruppe der Natrium-Kanal-Modulatoren / Spannungsabhängige Natrium-Kanal-Blocker: aus der Gruppe der Pyrethroide seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten die Typ I Pyrethroide Allethrin, Bioallethrin, Permethrin, Phenothrin, Resmethrin, Tetramethrin und die Typ II Pyrethroide (Alphacyanopyrethroide) Alpha-cypermethrin, Cyfluthrin (beta-), Cyhalothrin (lambda-), Cypermethrin (alpha-, zeta-), Deltamethrin, Fenvalerate, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvalinate (tau-), und die esterfreien Pyrethroide Etofenprox und Silafluofen genannt. Wirkstoffe aus dieser Klasse eignen sich ganz besonders als Mischpartner da sie eine längeranhaltende Kontakt-repellierende Wirkung haben und somit das Wirkspektrum um diese Komponente erweitern.

**[0099]** Aus Gruppe der Nikotinergen Acetylcholin-Rezeptor-Agonisten seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Chlothianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpyram, und Thiacloprid genannt; oder Nikotin oder Flupyradifurone.

**[0100]** Aus Gruppe der Allosterischen Acetylcholin-Rezeptor-Modulatoren (Agonisten) seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Spinosad und Spinetoram genannt.

**[0101]** Aus Gruppe der Chlorid-Kanal-Aktivatoren, seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Doramectin, Eprinomectin, Ivermectin, Milbemycin oxime, Moxidectin, Selamectin und Nodulisporinsäure A genannt.

**[0102]** Aus Gruppe der Juvenilhormon-Analoga, z. B. Hydroprene (S-), Kinoprene, Methoprene (S-); oder Fenoxycarb; Pyriproxyfen; seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Methoprene (S-) und Pyriproxyfen genannt.

**[0103]** Aus Gruppe der Milbenwachstumshemmer, seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Etoxazole genannt.

**[0104]** Aus Gruppe der Slo-1- und Latrophilin-Rezeptor Agonisten, wie beispielsweise zyklische Depsipeptide, z. B. Emodepsid sowie seine Ausgangsverbindung PF1022A (bekannt aus EP 382173, compound I) sei hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Emodepsid genannt.

**[0105]** Aus Gruppe der Inhibitoren der Chitinbiosynthese, Typ 0, wie beispielsweise Benzoylharnstoffe seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Diflubenzuron, Fluazuron, Lufenuron und Triflumuron genannt.

**[0106]** Aus Gruppe der Häutungsstörenden Wirkstoffe seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Cyromazin und Dicyclanil genannt.

**[0107]** Aus Gruppe der Oktopaminergen Agonisten seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Amitraz, Cymiazole und Demiditraz genannt.

**[0108]** Aus Gruppe der Komplex-I-Elektronentransportinhibitoren, wie beispielsweise aus der Gruppe der METI-Akarizide seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Fenpyroximate, Pyrimidifen und Tolfenpyrad genannt;

**[0109]** Aus Gruppe der Blocker des spannungsabhängigen Natriumkanals seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Indoxacarb und Metaflumizone genannt.

**[0110]** Aus Gruppe der Inhibitoren der Acetyl-CoA-Carboxylase, wie beispielsweise Tetronsäure-Derivate oder Tetramsäure-Derivate seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Spirodiclofen und Spiromesifen sowie Spirotetramat genannt.

**[0111]** Aus der Gruppe der Ryanodinrezeptor-Effektoren seien besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten Flubendiamide, Rynaxypyr und Cyazypyr genannt.

**[0112]** Aus der Gruppe der Effektoren mit unbekanntem Wirkmechanismus sei insbesondere 1-(3-Chlorpyridin-2-yl)-N-[4-cyan-2-methyl-6-(methylcarbamoyl)phenyl]-3-[[5-(trifluormethyl)-2H-tetrazol-2-yl]methyl]-1H-pyrazol-5-carboxamid (bekannt aus WO2010/069502) genannt.

**[0113]** Aus der Gruppe der zur weiteren Wirkungssteigerung einsetzbaren Synergisten seien hier besonders bevorzugt für Anwendungen gegen Ektoparasiten MGK264 (N-Octylbicycloheptencarboxamid), Piperonylbutoxid (PBO) und Verbutin genannt.

**[0114]** Zusätzlich zu diesen Gruppen können in Mischungen oder in Kombinationsanwendung auch Kurzzeitrepellentien verwendet werden. Beispiele sind DEET (N,N-diethyl-3-methylbenzamide), icaridin (1-Piperidine carboxylic acid), (1S, 20S)-2-methylpiperidinyl-3-cyclohexene-1-carboxamide (SS220), indalone (butyl 3,4-dihydro-2, 2-dimethyl-4-oxo-2H-pyran-6-carboxylate), dihydronepetalactones, nootkatone, IR3535 (3-[N-butyl-N-acetyl]-aminopropionic acid ethyl

ester), 2-Ethylhexane-1,3-diol, (1R,2R,5R)-2-(2-Hydroxypropan-2-yl)-5-methyl-cyclohexan-1-ol, Dimethyl benzene-1,2-dicarboxylate, Dodecanoic acid, Undecan-2-one, N,N-Diethyl-2-phenyl-acetamide und aetherische Öle oder andere Pflanzeninhaltsstoffef mit bekannter repellerender Wirkung wie z.B. Borneol, Callicarpenal, 1,8-Cineol (eucalyptol), Carvacrol, b-Citronellol, a-Copaene, Coumarin (oder seine synthetischen Derviate bekannt aus US20120329832), Beim Einsatz gegen Ectoparasiten besonders bevorzugt sind icaridin, indalone und IR3535 (3-[N-butyl-N-acetyl]-aminopropionic acid ethyl ester)

**[0115]** Von den vorstehend genannten Gruppen (I-1) bis (I-25) sind die folgenden Gruppen als Mischpartner bevorzugt: (I-2), (I-3), (I-4), (I-5), (I-6), (I-17), (I-25).

**[0116]** Ganz besonders bevorzugte Beispiele für insektizid oder akarizid wirksame Verbindungen, Synergisten oder Repellentien als Mischpartner der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sind Afoxolaner, Allethrin, Amitraz, Bioallethrin, Chlothianidin, Cyfluthrin (beta-), Cyhalothrin (lambda-), Cymiazole, Cypermethrin (alpha-, zeta-), Cyphenothrin, Deltamethrin, Demiditraz, Dinotefuran, Doramectin, Eprinomectin, Etofenprox, Fenvalerate, Fipronil, Fluzuron, Flucythrinate, Flumethrin, Fluralaner, Fluvalinate (tau-), Icaridin, Imidacloprid, Ivermectin, MGK264, Milbemycin oxime, Moxidectin, Nitenpyram, Permethrin, Phenothrin, Piperonylbutoxid, Pyriprole, Resmethrin, Selamectin, Silafluofen, Spinetoram, Spinosad, Tetramethrin, Thiacloprid.

**[0117]** Außerdem wurde gefunden, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören. Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

**[0118]** Weiter können die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombinationen mit anderen Wirkstoffen als Antifouling-Mittel eingesetzt werden.

**[0119]** Die Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen im Haushalts-, Hygiene- und Vorratsschutz, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam.

**[0120]** Unter Pflanzen werden alle Pflanzenarten, Pflanzensorten und Pflanzenpopulationen, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen verstanden. Erfindungsgemäß zu behandelnde Kulturpflanzen sind Pflanzen, die natürlich vorkommen, oder solche, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder durch Kombinationen der vorgenannten Methoden erhalten wurden. Der Begriff Kulturpflanze umfasst selbstverständlich auch transgene Pflanzen.

**[0121]** Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften, sogenannten Traits, die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken oder einer Kombination hieraus gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

**[0122]** Unter Pflanzenteilen werden alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden, insbesondere Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten,

**[0123]** Fruchtkörper, Früchte, Samen, Wurzeln, Knollen und Rhizome. Der Begriff Pflanzenteile umfasst weiterhin Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, wie z.B. Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen bzw. Saatgut.

**[0124]** In einer erfindungsgemäßen Ausführungsform werden natürlich vorkommende oder durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden (z.B. Kreuzung oder Protoplastenfusion) erhaltene Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Pflanzenteile behandelt.

**[0125]** In einer weiteren erfindungsgemäßen Ausführungsform werden transgene Pflanzen, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden und deren Teile behandelt.

**[0126]** Das erfindungsgemäße Behandlungsverfahren wird vorzugsweise auf genetisch modifizierten Organismen, wie beispielsweise Pflanzen oder Pflanzenteile, verwendet.

**[0127]** Genetisch modifizierte Pflanzen, sogenannte transgene Pflanzen, sind Pflanzen, bei denen ein heterologes Gen stabil in das Genom integriert worden ist.

**[0128]** Der Begriff "heterologes Gen" bedeutet im wesentlichen ein Gen, das außerhalb der Pflanze bereitgestellt oder assembliert wird und das bei Einführung in das Zellkerngenom, das Chloroplastengenom oder das Hypochondriengenom der transformierten Pflanze dadurch neue oder verbesserte agronomische oder sonstige Eigenschaften verleiht, daß es ein interessierendes Protein oder Polypeptid exprimiert oder daß es ein anderes Gen, das in der Pflanze vorliegt bzw. andere Gene, die in der Pflanze vorliegen, herunterreguliert oder abschaltet (zum Beispiel mittels Antisense-Technologie, Cosuppressionstechnologie oder RNAi-Technologie [RNA Interference]). Ein heterologes Gen, das im Genom vorliegt, wird ebenfalls als Transgen bezeichnet. Ein Transgen, das durch sein spezifisches Vorliegen im Pflanzengenom definiert ist, wird als Transformations- bzw. transgenes Event bezeichnet.

**[0129]** In Abhängigkeit von den Pflanzenarten oder Pflanzensorten, ihrem Standort und ihren Wachstumsbedingungen

(Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) kann die erfindungsgemäße Behandlung auch zu überadditiven ("synergistischen") Effekten führen. So sind zum Beispiel die folgenden Effekte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen: verringerte Aufwandmengen und/oder erweitertes Wirkungsspektrum und/oder erhöhte Wirksamkeit der Wirkstoffe und Zusammensetzungen, die erfindungsgemäß eingesetzt werden können, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegenüber Trockenheit oder Wasser- oder Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, Ernteerleichterung, Reifebeschleunigung, höhere Erträge, größere Früchte, größere Pflanzenhöhe, intensiver grüne Farbe des Blatts, frühere Blüte, höhere Qualität und/oder höherer Nährwert der Ernteprodukte, höhere Zuckerkonzentration in den Früchten, bessere Lagerfähigkeit und/oder Verarbeitbarkeit der Ernteprodukte.

**[0130]** In gewissen Aufwandmengen können die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen auch eine stärkende Wirkung auf Pflanzen ausüben. Sie eignen sich daher für die Mobilisierung des pflanzlichen Abwehrsystems gegen Angriff durch unerwünschte phytopathogene Pilze und/oder Mikroorganismen und/oder Viren. Dies kann gegebenenfalls einer der Gründe für die erhöhte Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Kombinationen sein, zum Beispiel gegen Pilze. Pflanzenstärkende (resistenzinduzierende) Substanzen sollen im vorliegenden Zusammenhang auch solche Substanzen oder Substanzkombinationen bedeuten, die fähig sind, das pflanzliche Abwehrsystem so zu stimulieren, daß die behandelten Pflanzen, wenn sie im Anschluß daran mit unerwünschten phytopathogenen Pilzen und/oder Mikroorganismen und/oder Viren inokuliert werde, einen beträchtlichen Resistenzgrad gegen diese unerwünschten phytopathogenen Pilze und/oder Mikroorganismen und/oder Viren aufweisen. Im vorliegenden Fall versteht man unter unerwünschten phytopathogenen Pilzen und/oder Mikroorganismen und/oder Viren phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren. Die erfindungsgemäßen Substanzen lassen sich daher zum Schutz von Pflanzen gegen Angriff durch die erwähnten Pathogene innerhalb eines gewissen Zeitraums nach der Behandlung einsetzen. Der Zeitraum, über den eine Schutzwirkung erzielt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tagen, vorzugsweise 1 bis 7 Tagen, nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

**[0131]** Pflanzen, die weiterhin vorzugsweise erfindungsgemäß behandelt werden, sind gegen einen oder mehrere biotische Streßfaktoren resistent, d. h. diese Pflanzen weisen eine verbesserte Abwehr gegen tierische und mikrobielle Schädlinge wie Nematoden, Insekten, Milben, phytopathogene Pilze, Bakterien, Viren und/oder Viroide auf.

**[0132]** Neben den vorgenannten Pflanzen und Pflanzensorten, können auch solche erfindungsgemäß behandelt werden, die gegen einen oder mehrere abiotische Streßfaktoren widerstandsfähig sind.

**[0133]** Zu den abiotischen Streßbedingungen können zum Beispiel Dürre, Kälte- und Hitzebedingungen, osmotischer Streß, Staunässe, erhöhter Bodensalzgehalt, erhöhtes Ausgesetztsein an Mineralien, Ozonbedingungen, Starklichtbedingungen, beschränkte Verfügbarkeit von Stickstoffnährstoffen, beschränkte Verfügbarkeit von Phosphornährstoffen oder Vermeidung von Schatten zählen.

**[0134]** Pflanzen und Pflanzensorten, die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind solche Pflanzen, die durch erhöhte Ertragseigenschaften gekennzeichnet sind. Ein erhöhter Ertrag kann bei diesen Pflanzen z. B. auf verbesserter Pflanzenphysiologie, verbessertem Pflanzenwuchs und verbesserter Pflanzenentwicklung, wie Wasserverwertungseffizienz, Wasserhalteeffizienz, verbesserter Stickstoffverwertung, erhöhter Kohlenstoffassimilation, verbesserter Photosynthese, verstärkter Keimkraft und beschleunigter Abreife beruhen. Der Ertrag kann weiterhin durch eine verbesserte Pflanzenarchitektur (unter Streß- und nicht-Streß-Bedingungen) beeinflusst werden, darunter frühe Blüte, Kontrolle der Blüte für die Produktion von Hybridsaatgut, Keimpflanzenwüchsigkeit, Pflanzengröße, Internodienzahl und -abstand, Wurzelwachstum, Samengröße, Fruchtgröße, Schotengröße, Schoten- oder Ährenzahl, Anzahl der Samen pro Schote oder Ähre, Samenmasse, verstärkte Samenfüllung, verringerter Samenausfall, verringertes Schotenplatzen sowie Standfestigkeit. Zu weiteren Ertragsmerkmalen zählen Samenzusammensetzung wie Kohlenhydratgehalt, Proteingehalt, Ölgehalt und Ölzusammensetzung, Nährwert, Verringerung der nährwidrigen Verbindungen, verbesserte Verarbeitbarkeit und verbesserte Lagerfähigkeit.

**[0135]** Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Hybridpflanzen, die bereits die Eigenschaften der Heterosis bzw. des Hybrideffekts exprimieren, was im allgemeinen zu höherem Ertrag, höherer Wüchsigkeit, besserer Gesundheit und besserer Resistenz gegen biotische und abiotische Streßfaktoren führt. Solche Pflanzen werden typischerweise dadurch erzeugt, daß man eine ingezüchtete pollensterile Elternlinie (den weiblichen Kreuzungspartner) mit einer anderen ingezüchteten pollenfertilen Elternlinie (dem männlichen Kreuzungspartner) kreuzt. Das Hybridsaatgut wird typischerweise von den pollensterilen Pflanzen geerntet und an Vermehrer verkauft. Pollensterile Pflanzen können manchmal (z. B. beim Mais) durch Entfahnen (d. h. mechanischem Entfernen der männlichen Geschlechtsorgane bzw. der männlichen Blüten), produziert werden; es ist jedoch üblicher, daß die Pollensterilität auf genetischen Determinanten im Pflanzengenom beruht. In diesem Fall, insbesondere dann, wenn es sich bei dem gewünschten Produkt, da man von den Hybridpflanzen ernten will, um die Samen handelt, ist es üblicherweise günstig, sicherzustellen, daß die Pollenfertilität in Hybridpflanzen, die die für die Pollensterilität verantwortlichen genetischen Determinanten enthalten, völlig restoriert wird. Dies kann erreicht werden, indem sichergestellt wird, daß die männlichen Kreuzungspartner entsprechende Fertilitätsrestorerogene besitzen, die in der Lage sind, die Pollenfertilität in Hybridpflanzen, die die genetischen Determinanten, die für die Pollensterilität verantwortlich sind, enthalten, zu restorieren. Genetische Determinanten für

Pollensterilität können im Cytoplasma lokalisiert sein. Beispiele für cytoplasmatische Pollensterilität (CMS) wurden zum Beispiel für Brassica-Arten beschrieben. Genetische Determinanten für Pollensterilität können jedoch auch im Zellkern-genom lokalisiert sein. Pollensterile Pflanzen können auch mit Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie Gentechnik, erhalten werden. Ein besonders günstiges Mittel zur Erzeugung von pollensterilen Pflanzen ist in WO 89/10396 beschrieben, wobei zum Beispiel eine Ribonuklease wie eine Barnase selektiv in den Tapetumzellen in den Staubblättern exprimiert wird. Die Fertilität kann dann durch Expression eines Ribonukleasehemmers wie Barstar in den Tapetumzellen restoriert werden.

**[0136]** Pflanzen oder Pflanzensorten (die mit Methoden der Pflanzenbiotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten werden), die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind herbizidtolerante Pflanzen, d. h. Pflanzen, die gegenüber einem oder mehreren vorgegebenen Herbiziden tolerant gemacht worden sind. Solche Pflanzen können entweder durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine Herbizidtoleranz verleiht, erhalten werden.

**[0137]** Herbizidtolerante Pflanzen sind zum Beispiel glyphosatetolerante Pflanzen, d. h. Pflanzen, die gegenüber dem Herbizid Glyphosate oder dessen Salzen tolerant gemacht worden sind. So können zum Beispiel glyphosatetolerante Pflanzen durch Transformation der Pflanze mit einem Gen, das für das Enzym 5-Enolpyruvylshikimat-3-phosphatsynthase (EPSPS) kodiert, erhalten werden. Beispiele für solche EPSPS-Gene sind das AroA-Gen (Mutante CT7) des Bakterium *Salmonella typhimurium*, das CP4-Gen des Bakteriums *Agrobacterium sp.*, die Gene, die für eine EPSPS aus der Petunie, für eine EPSPS aus der Tomate oder für eine EPSPS aus Eleusine kodieren. Es kann sich auch um eine mutierte EPSPS handeln. Glyphosatetolerante Pflanzen können auch dadurch erhalten werden, daß man ein Gen exprimiert, das für ein Glyphosate-Oxidoreduktase-Enzym kodiert. Glyphosatetolerante Pflanzen können auch dadurch erhalten werden, daß man ein Gen exprimiert, das für ein Glyphosateacetyltransferase-Enzym kodiert. Glyphosatetolerante Pflanzen können auch dadurch erhalten werden, daß man Pflanzen, die natürlich vorkommende Mutationen der oben erwähnten Gene selektiert.

**[0138]** Sonstige herbizidresistente Pflanzen sind zum Beispiel Pflanzen, die gegenüber Herbiziden, die das Enzym Glutaminsynthase hemmen, wie Bialaphos, Phosphinotricin oder Glufosinate, tolerant gemacht worden sind. Solche Pflanzen können dadurch erhalten werden, daß man ein Enzym exprimiert, das das Herbizid oder eine Mutante des Enzyms Glutaminsynthase, das gegenüber Hemmung resistent ist, entgiftet. Solch ein wirksames entgiftendes Enzym ist zum Beispiel ein Enzym, das für ein Phosphinotricin-acetyltransferase kodiert (wie zum Beispiel das bar- oder pat-Protein aus *Streptomyces*-Arten). Pflanzen, die eine exogene Phosphinotricin-acetyltransferase exprimieren, sind beschrieben.

**[0139]** Weitere herbizidtolerante Pflanzen sind auch Pflanzen, die gegenüber den Herbiziden, die das Enzym Hydroxyphenylpyruvatdioxygenase (HPPD) hemmen, tolerant gemacht worden sind. Bei den Hydroxyphenylpyruvatdioxygenasen handelt es sich um Enzyme, die die Reaktion, in der para-Hydroxyphenylpyruvat (HPP) zu Homogentisat umgesetzt wird, katalysieren. Pflanzen, die gegenüber HPPD-Hemmern tolerant sind, können mit einem Gen, das für ein natürlich vorkommendes resistentes HPPD-Enzym kodiert, oder einem Gen, das für ein mutiertes HPPD-Enzym kodiert, transformiert werden. Eine Toleranz gegenüber HPPD-Hemmern kann auch dadurch erzielt werden, daß man Pflanzen mit Genen transformiert, die für gewisse Enzyme kodieren, die die Bildung von Homogentisat trotz Hemmung des nativen HPPD-Enzyms durch den HPPD-Hemmer ermöglichen. Die Toleranz von Pflanzen gegenüber HPPD-Hemmern kann auch dadurch verbessert werden, daß man Pflanzen zusätzlich zu einem Gen, das für ein HPPD-tolerantes Enzym kodiert, mit einem Gen transformiert, das für ein Prephenatdehydrogenase-Enzym kodiert.

**[0140]** Weitere herbizidresistente Pflanzen sind Pflanzen, die gegenüber Acetolactatsynthase (ALS)-Hemmern tolerant gemacht worden sind. Zu bekannten ALS-Hemmern zählen zum Beispiel Sulfonylharnstoff, Imidazolinon, Triazolopyrimidine, Pyrimidinyloxy(thio)benzoate und/oder Sulfonylaminocarbonyltriazolinon-Herbizide. Es ist bekannt, daß verschiedene Mutationen im Enzym ALS (auch als Acetohydroxysäure-Synthase, AHAS, bekannt) eine Toleranz gegenüber unterschiedlichen Herbiziden bzw. Gruppen von Herbiziden verleihen. Die Herstellung von sulfonylharnstofftoleranten Pflanzen und imidazolinontoleranten Pflanzen ist in der internationalen Veröffentlichung WO 1996/033270 beschrieben. Weitere sulfonylharnstoff- und imidazolinontolerante Pflanzen sind auch in z.B. WO 2007/024782 beschrieben.

**[0141]** Weitere Pflanzen, die gegenüber Imidazolinon und/oder Sulfonylharnstoff tolerant sind, können durch induzierte Mutagenese, Selektion in Zellkulturen in Gegenwart des Herbizids oder durch Mutationszüchtung erhalten werden.

**[0142]** Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind insektenresistente transgene Pflanzen, d.h. Pflanzen, die gegen Befall mit gewissen Zielinsekten resistent gemacht wurden. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine Insektenresistenz verleiht, erhalten werden.

**[0143]** Der Begriff "insektenresistente transgene Pflanze" umfaßt im vorliegenden Zusammenhang jegliche Pflanze, die mindestens ein Transgen enthält, das eine Kodiersequenz umfaßt, die für folgendes kodiert:

## EP 2 953 942 B1

1) ein insektizides Kristallprotein aus *Bacillus thuringiensis* oder einen insektiziden Teil davon, wie die insektiziden Kristallproteine, die online bei: [http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil\\_Crickmore/Bt/](http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/) beschrieben sind, zusammengestellt wurden, oder insektizide Teile davon, z.B. Proteine der Cry-Proteinklassen Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae oder Cry3Bb oder insektizide Teile davon; oder

5

2) ein Kristallprotein aus *Bacillus thuringiensis* oder einen Teil davon, der in Gegenwart eines zweiten, anderen Kristallproteins als *Bacillus thuringiensis* oder eines Teils davon insektizid wirkt, wie das binäre Toxin, das aus den Kristallproteinen Cy34 und Cy35 besteht; oder

10

3) ein insektizides Hybridprotein, das Teile von zwei unterschiedlichen insektiziden Kristallproteinen aus *Bacillus thuringiensis* umfaßt, wie zum Beispiel ein Hybrid aus den Proteinen von 1) oben oder ein Hybrid aus den Proteinen von 2) oben, z. B. das Protein Cry1A.105, das von dem Mais-Event MON98034 produziert wird (WO 2007/027777); oder

15

4) ein Protein gemäß einem der Punkte 1) bis 3) oben, in dem einige, insbesondere 1 bis 10, Aminosäuren durch eine andere Aminosäure ersetzt wurden, um eine höhere insektizide Wirksamkeit gegenüber einer Zielinsektenart zu erzielen und/oder um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern und/oder wegen Veränderungen, die in die Kodier-DNA während der Klonierung oder Transformation induziert wurden, wie das Protein Cry3Bb1 in Mais-Events MON863 oder MON88017 oder das Protein Cry3A im Mais-Event MIR 604;

20

5) ein insektizides sezerniertes Protein aus *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus* oder einen insektiziden Teil davon, wie die vegetativ wirkenden insektentoxischen Proteine (vegetative insecticidal proteins, VIP), die unter [http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil\\_Crickmore/Bt/vip.html](http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html) angeführt sind, z. B. Proteine der Proteinklasse VIP3Aa; oder

25

6) ein sezerniertes Protein aus *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus*, das in Gegenwart eines zweiten sezernierten Proteins aus *Bacillus thuringiensis* oder *B. cereus* insektizid wirkt, wie das binäre Toxin, das aus den Proteinen VIP1A und VIP2A besteht.

30

7) ein insektizides Hybridprotein, das Teile von verschiedenen sezernierten Proteinen von *Bacillus thuringiensis* oder *Bacillus cereus* umfaßt, wie ein Hybrid der Proteine von 1) oder ein Hybrid der Proteine von 2) oben; oder

35

8) ein Protein gemäß einem der Punkte 1) bis 3) oben, in dem einige, insbesondere 1 bis 10, Aminosäuren durch eine andere Aminosäure ersetzt wurden, um eine höhere insektizide Wirksamkeit gegenüber einer Zielinsektenart zu erzielen und/oder um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern und/oder wegen Veränderungen, die in die Kodier-DNA während der Klonierung oder Transformation induziert wurden (wobei die Kodierung für ein insektizides Protein erhalten bleibt), wie das Protein VIP3Aa im Baumwoll-Event COT 102.

40

**[0144]** Natürlich zählt zu den insektenresistenten transgenen Pflanzen im vorliegenden Zusammenhang auch jegliche Pflanze, die eine Kombination von Genen umfaßt, die für die Proteine von einer der oben genannten Klassen 1 bis 8 kodieren. In einer Ausführungsform enthält eine insektenresistente Pflanze mehr als ein Transgen, das für ein Protein nach einer der oben genannten 1 bis 8 kodiert, um das Spektrum der entsprechenden Zielinsektenarten zu erweitern oder um die Entwicklung einer Resistenz der Insekten gegen die Pflanzen dadurch hinauszuzögern, daß man verschiedene Proteine einsetzt, die für dieselbe Zielinsektenart insektizid sind, jedoch eine unterschiedliche Wirkungsweise, wie Bindung an unterschiedliche Rezeptorbindungsstellen im Insekt, aufweisen.

45

**[0145]** Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind gegenüber abiotischen Streßfaktoren tolerant. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solch eine Streßresistenz verleiht, erhalten werden. Zu besonders nützlichen Pflanzen mit Streßtoleranz zählen folgende:

50

a. Pflanzen, die ein Transgen enthalten, das die Expression und/oder Aktivität des Gens für die Poly(ADP-ribose)polymerase (PARP) in den Pflanzenzellen oder Pflanzen zu reduzieren vermag.

55

b. Pflanzen, die ein streßtoleranzförderndes Transgen enthalten, das die Expression und/oder Aktivität der für PARP kodierenden Gene der Pflanzen oder Pflanzenzellen zu reduzieren vermag;

c. Pflanzen, die ein streßtoleranzförderndes Transgen enthalten, das für ein in Pflanzen funktionelles Enzym des

## EP 2 953 942 B1

Nicotinamidadenindinukleotid-Salvage-Biosynthesewegs kodiert, darunter Nicotinamidase, Nicotinatphosphoribosyltransferase, Nicotinsäuremononukleotidadenyltransferase, Nicotinamidadenindinukleotidsynthetase oder Nicotinamidphosphoribosyltransferase.

5 **[0146]** Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, weisen eine veränderte Menge, Qualität und/oder Lagerfähigkeit des Ernteprodukts und/oder veränderte Eigenschaften von bestimmten Bestandteilen des Ernteprodukts auf, wie zum Beispiel:

10 1) Transgene Pflanzen, die eine modifizierte Stärke synthetisieren, die bezüglich ihrer chemischphysikalischen Eigenschaften, insbesondere des Amylosegehalts oder des Amylose/Amylopektin-Verhältnisses, des Verzweigungsgrads, der durchschnittlichen Kettenlänge, der Verteilung der Seitenketten, des Viskositätsverhaltens, der Gelfestigkeit, der Stärkekorngröße und/oder Stärkekornmorphologie im Vergleich mit der synthetisierten Stärke in Wildtyppflanzenzellen oder -pflanzen verändert ist, so daß sich diese modifizierte Stärke besser für bestimmte  
15 Anwendungen eignet.

2) Transgene Pflanzen, die Nichtstärkekohlenhydratpolymere synthetisieren, oder Nichtstärkekohlenhydratpolymere, deren Eigenschaften im Vergleich zu Wildtyppflanzen ohne genetische Modifikation verändert sind. Beispiele sind Pflanzen, die Polyfructose, insbesondere des Inulin- und Levantyps, produzieren, Pflanzen, die alpha-1,4-Glucane produzieren, Pflanzen, die alpha-1,6-verzweigte alpha-1,4-Glucane produzieren und Pflanzen, die Alternan  
20 produzieren.

3) Transgene Pflanzen, die Hyaluronan produzieren.

25 **[0147]** Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit veränderten Fasereigenschaften. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solche veränderten Fasereigenschaften verleiht, erhalten werden; dazu zählen:

30 a) Pflanzen wie Baumwollpflanzen, die eine veränderte Form von Cellulosesynthasegenen enthalten,

b) Pflanzen wie Baumwollpflanzen, die eine veränderte Form von rsw2- oder rsw3-homologen Nukleinsäuren enthalten;

35 c) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit einer erhöhten Expression der Saccharosephosphatsynthase;

d) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit einer erhöhten Expression der Saccharosesynthase;

40 e) Pflanzen wie Baumwollpflanzen bei denen der Zeitpunkt der Durchlaßsteuerung der Plasmodesmen an der Basis der Faserzelle verändert ist, z. B. durch Herunterregulieren der faserselektiven  $\beta$ -1,3-Glucanase;

f) Pflanzen wie Baumwollpflanzen mit Fasern mit veränderter Reaktivität, z. B. durch Expression des N-Acetylglucosamintransferasegenen, darunter auch nodC, und von Chitinsynthasegenen.

45 **[0148]** Pflanzen oder Pflanzensorten (die nach Methoden der pflanzlichen Biotechnologie, wie der Gentechnik, erhalten wurden), die ebenfalls erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen wie Raps oder verwandte Brassica-Pflanzen mit veränderten Eigenschaften der Ölzusammensetzung. Solche Pflanzen können durch genetische Transformation oder durch Selektion von Pflanzen, die eine Mutation enthalten, die solche veränderten Öleigenschaften verleiht, erhalten werden; dazu zählen:

50 a) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem hohen Ölsäuregehalt produziere;

b) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem niedrigen Linolensäuregehalt produzieren.

55 c) Pflanzen wie Rapspflanzen, die Öl mit einem niedrigen gesättigten Fettsäuregehalt produzieren.

**[0149]** Besonders nützliche transgene Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen mit einem oder mehreren Genen, die für ein oder mehrere Toxine kodieren, sind die transgenen Pflanzen, die unter den

folgenden Handelsbezeichnungen angeboten werden: YIELD GARD® (zum Beispiel Mais, Baumwolle, Sojabohnen), KnockOut® (zum Beispiel Mais), BiteGard® (zum Beispiel Mais), BT-Xtra® (zum Beispiel Mais), StarLink® (zum Beispiel Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle), Nucotn 33B® (Baumwolle), NatureGard® (zum Beispiel Mais), Protecta® und NewLeaf® (Kartoffel). Herbizidtolerante Pflanzen, die zu erwähnen sind, sind zum Beispiel Maissorten, Baumwollsorten und Sojabohnensorten, die unter den folgenden Handelsbezeichnungen angeboten werden: Roundup Ready® (Glyphosatetoleranz, zum Beispiel Mais, Baumwolle, Sojabohne), Liberty Link® (Phosphinotricintoleranz, zum Beispiel Raps), IMI® (Imidazolinontoleranz) und SCS® (Sylfonylharnstofftoleranz), zum Beispiel Mais. Zu den herbizid-resistenten Pflanzen (traditionell auf Herbizidtoleranz gezüchtete Pflanzen), die zu erwähnen sind, zählen die unter der Bezeichnung Clearfield® angebotenen Sorten (zum Beispiel Mais).

**[0150]** Besonders nützliche transgene Pflanzen, die erfindungsgemäß behandelt werden können, sind Pflanzen, die Transformations-Events, oder eine Kombination von Transformations-Events, enthalten und die zum Beispiel in den Dateien von verschiedenen nationalen oder regionalen Behörden angeführt sind (siehe zum Beispiel [http://gmoinfo.jrc.it/gmp\\_browse.aspx](http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx) und <http://www.agbios.com/dbase.php>).

**[0151]** Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffkombinationen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Saatgut, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

**[0152]** Insbesondere eignen sich die erfindungsgemäßen Mischungen zur Behandlung von Saatgut. Bevorzugt sind dabei die vorstehend als bevorzugt oder besonders bevorzugt genannten erfindungsgemäßen Kombinationen zu nennen. So entsteht ein großer Teil des durch Schädlinge verursachten Schadens an Kulturpflanzen bereits durch den Befall des Saatguts während der Lagerung und nach dem Einbringen des Saatguts in den Boden sowie während und unmittelbar nach der Keimung der Pflanzen. Diese Phase ist besonders kritisch, da die Wurzeln und Sprosse der wachsenden Pflanze besonders empfindlich sind und bereits ein geringer Schaden zum Absterben der ganzen Pflanze führen kann. Es besteht daher ein insbesondere großes Interesse daran, das Saatgut und die keimende Pflanze durch den Einsatz geeigneter Mittel zu schützen.

**[0153]** Die Bekämpfung von Schädlingen durch die Behandlung des Saatguts von Pflanzen ist seit langem bekannt und ist Gegenstand ständiger Verbesserungen. Dennoch ergeben sich bei der Behandlung von Saatgut eine Reihe von Problemen, die nicht immer zufriedenstellend gelöst werden können. So ist es erstrebenswert, Verfahren zum Schutz des Saatguts und der keimenden Pflanze zu entwickeln, die das zusätzliche Ausbringen von Pflanzenschutzmitteln nach der Saat oder nach dem Auflaufen der Pflanzen überflüssig machen. Es ist weiterhin erstrebenswert, die Menge des eingesetzten Wirkstoffs dahingehend zu optimieren, dass das Saatgut und die keimende Pflanze vor dem Befall durch Schädlinge bestmöglich geschützt wird, ohne jedoch die Pflanze selbst durch den eingesetzten Wirkstoff zu schädigen. Insbesondere sollten Verfahren zur Behandlung von Saatgut auch die intrinsischen insektiziden Eigenschaften transgener Pflanzen einbeziehen, um einen optimalen Schutz des Saatguts und auch der keimenden Pflanze bei einem minimalen Aufwand an Pflanzenschutzmitteln zu erreichen.

**[0154]** Die vorliegende Erfindung bezieht sich daher insbesondere auch auf ein Verfahren zum Schutz von Saatgut und keimenden Pflanzen vor dem Befall von Schädlingen, indem das Saatgut mit einem erfindungsgemäßen Mittel behandelt wird. Die Erfindung bezieht sich ebenfalls auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Mittel zur Behandlung von Saatgut zum Schutz des Saatguts und der daraus entstehenden Pflanze vor Schädlingen. Weiterhin bezieht sich die Erfindung auf Saatgut, welches zum Schutz vor Schädlingen mit einem erfindungsgemäßen Mittel behandelt wurde.

**[0155]** Einer der Vorteile der vorliegenden Erfindung ist es, dass aufgrund der besonderen systemischen Eigenschaften der erfindungsgemäßen Mittel die Behandlung des Saatguts mit diesen Mitteln nicht nur das Saatgut selbst, sondern auch die daraus hervorgehenden Pflanzen nach dem Auflaufen vor Schädlingen schützt. Auf diese Weise kann die unmittelbare Behandlung der Kultur zum Zeitpunkt der Aussaat oder kurz danach entfallen.

**[0156]** Ein weiterer Vorteil besteht in der synergistischen Erhöhung der insektiziden Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Mittel gegenüber dem insektiziden Einzelwirkstoff, die über die zu erwartende Wirksamkeit der beiden einzeln angewendeten Wirkstoffe hinausgeht. Vorteilhaft ist auch die synergistische Erhöhung der fungiziden Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Mittel gegenüber dem fungiziden Einzelwirkstoff, die über die zu erwartende Wirksamkeit des einzeln angewendeten Wirkstoffs hinausgeht. Damit wird eine Optimierung der Menge der eingesetzten Wirkstoffe ermöglicht.

**[0157]** Ebenso ist es als vorteilhaft anzusehen, dass die erfindungsgemäßen Mischungen insbesondere auch bei transgenem Saatgut eingesetzt werden können, wobei die aus diesem Saatgut hervorgehenden Pflanzen zur Expression eines gegen Schädlinge gerichteten Proteins befähigt sind. Durch die Behandlung solchen Saatguts mit den erfindungsgemäßen Mitteln können bestimmte Schädlinge bereits durch die Expression des z.B. insektiziden Proteins kontrolliert werden, und zusätzlich durch die erfindungsgemäßen Mittel vor Schäden bewahrt werden.

**[0158]** Die erfindungsgemäßen Mittel eignen sich zum Schutz von Saatgut jeglicher Pflanzensorte wie bereits vorstehend genannt, die in der Landwirtschaft, im Gewächshaus, in Forsten oder im Gartenbau eingesetzt wird. Insbesondere handelt es sich dabei um Saatgut von Mais, Erdnuss, Canola, Raps, Mohn, Soja, Baumwolle, Rübe (z.B. Zuckerrübe und Futterrübe), Reis, Hirse, Weizen, Gerste, Hafer, Roggen, Sonnenblume, Tabak, Kartoffeln oder Gemüse (z.B.

Tomaten, Kohlgewächs). Die erfindungsgemäßen Mittel eignen sich ebenfalls zur Behandlung des Saatguts von Obstpflanzen und Gemüse wie vorstehend bereits genannt. Besondere Bedeutung kommt der Behandlung des Saatguts von Mais, Soja, Baumwolle, Weizen und Canola oder Raps zu.

**[0159]** Wie vorstehend bereits erwähnt, kommt auch der Behandlung von transgenem Saatgut mit einem erfindungsgemäßen Mittel eine besondere Bedeutung zu. Dabei handelt es sich um das Saatgut von Pflanzen, die in der Regel zumindest ein heterologes Gen enthalten, das die Expression eines Polypeptids mit insbesondere insektiziden Eigenschaften steuert. Die heterologen Gene in transgenem Saatgut können dabei aus Mikroorganismen wie *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* oder *Gliocladium* stammen. Die vorliegende Erfindung eignet sich besonders für die Behandlung von transgenem Saatgut, das zumindest ein heterologes Gen enthält, das aus *Bacillus sp.* stammt und dessen Genprodukt Wirksamkeit gegen Maiszünsler und/oder Maiswurzel-Bohrer zeigt. Besonders bevorzugt handelt es sich dabei um ein heterologes Gen, das aus *Bacillus thuringiensis* stammt.

**[0160]** Im Rahmen der vorliegenden Erfindung wird das erfindungsgemäße Mittel alleine oder in einer geeigneten Formulierung auf das Saatgut aufgebracht. Vorzugsweise wird das Saatgut in einem Zustand behandelt, in dem so stabil ist, dass keine Schäden bei der Behandlung auftreten. Im Allgemeinen kann die Behandlung des Saatguts zu jedem Zeitpunkt zwischen der Ernte und der Aussaat erfolgen. Üblicherweise wird Saatgut verwendet, das von der Pflanze getrennt und von Kolben, Schalen, Stängeln, Hülle, Wolle oder Fruchtfleisch befreit wurde.

**[0161]** Im Allgemeinen muss bei der Behandlung des Saatguts darauf geachtet werden, dass die Menge des auf das Saatgut aufgetragenen erfindungsgemäßen Mittels und/oder weiterer Zusatzstoffe so gewählt wird, dass die Keimung des Saatguts nicht beeinträchtigt bzw. die daraus hervorgehende Pflanze nicht geschädigt wird. Dies ist vor allem bei Wirkstoffen zu beachten, die in bestimmten Aufwandmengen phytotoxische Effekte zeigen können.

**[0162]** Darüber hinaus können die erfindungsgemäßen Verbindungen zur Bekämpfung einer Vielzahl verschiedener Schädlinge einschließlich beispielsweise schädlicher saugender Insekten, beißender Insekten und anderen an Pflanzen parasitierenden Schädlingen, Vorratsschädlingen, Schädlingen, die industrielle Materialien zerstören und Hygieneschädlingen einschließlich Parasiten im Bereich Tiergesundheit verwendet und zu ihrer Bekämpfung wie zum Beispiel ihrer Auslöschung und Ausmerzungen eingesetzt werden. Die vorliegende Erfindung schließt somit auch ein Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen ein.

**[0163]** Im Bereich Tiergesundheit, d.h. auf dem veterinärmedizinischen Gebiet, wirken die Wirkstoffe gemäß der vorliegenden Erfindung gegen tierische Parasiten, insbesondere Ektoparasiten oder Endoparasiten. Der Begriff Endoparasiten schließt insbesondere Helminthen wie Cestoden, Nematoden oder Trematoden, und Protozoen wie Kozzidien ein. Ektoparasiten sind typischerweise und vorzugsweise Arthropoden, insbesondere Insekten wie Fliegen (stechend und leckend), parasitische Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge, Flöhe und dergleichen; oder Akariden wie Zecken, zum Beispiel Schildzecken oder Lederzecken, oder Milben wie Räude milben, Laufmilben, Federmilben und dergleichen.

**[0164]** Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phthirus spp.*, *Solenopotes spp.*; spezielle Beispiele sind: *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*, *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus euryternus*, *Haematopinus suis*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*;

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina und Ischnocerina z.B. *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.*, *Felicola spp.*; spezielle Beispiele sind: *Bovicola bovis*, *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Damalina bovis*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostratus*, *Bovicola caprae*, *Lepikentron ovis*, *Werneckiella equi*;

Aus der Ordnung der Diptera und den Unterordnungen Nematocera und Brachycera z.B. *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops spp.*, *Odagmia spp.*, *Wilhelmia spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Calliphora spp.*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.*, *Melophagus spp.*, *Rhinoestrus spp.*, *Tipula spp.*; spezielle Beispiele sind: *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles maculipennis*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Simulium reptans*, *Phlebotomus papatasi*, *Phlebotomus longipalpis*, *Odagmia ornata*, *Wilhelmia equina*, *Bomophthora erythrocephala*, *Tabanus bromius*, *Tabanus spodopterus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus sudeticus*, *Hybomitra ciurea*, *Chrysops caecutiens*, *Chrysops relictus*, *Haematopota pluvialis*, *Haematopota italica*, *Musca autumnalis*,

Musca domestica, Haematobia irritans irritans, Haematobia irritans exigua, Haematobia stimulans, Hydrotaea irritans, Hydrotaea albipuncta, Chrysomya chloropyga, Chrysomya bezziana, Oestrus ovis, Hypoderma bovis, Hypoderma lineatum, Przhivalskiana silenus, Dermatobia hominis, Melophagus ovinus, Lipoptena capreoli, Lipoptena cervi, Hippobosca variegata, Hippobosca equina, Gasterophilus intestinalis, Gasterophilus haemorroidalis, Gasterophilus inermis, Gasterophilus nasalis, Gasterophilus nigricornis, Gasterophilus pecorum, Braula coeca;

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Tunga spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.; spezielle Beispiele sind: Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.

**[0165]** Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp. (z.B. Supella longipalpa);

Aus der Unterklasse der Acari (Acarina) und den Ordnungen der Meta- und Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Rhipicephalus (Boophilus) spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Dermanyssus spp., Rhipicephalus spp. (der ursprünglichen Gattung der Mehrwirtszecken), Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp., Acarapis spp.; spezielle Beispiele sind: Argas persicus, Argas reflexus, Ornithodoros moubata, Otobius megnini, Rhipicephalus (Boophilus) microplus, Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus, Rhipicephalus (Boophilus) annulatus, Rhipicephalus (Boophilus) calceratus, Hyalomma anatolicum, Hyalomma aegypticum, Hyalomma marginatum, Hyalomma transiens, Rhipicephalus evertsi, Ixodes ricinus, Ixodes hexagonus, Ixodes canisuga, Ixodes pilosus, Ixodes rubicundus, Ixodes scapularis, Ixodes holocyclus, Haemaphysalis concinna, Haemaphysalis punctata, Haemaphysalis cinnabarina, Haemaphysalis otophila, Haemaphysalis leachi, Haemaphysalis longicorni, Dermacentor marginatus, Dermacentor reticulatus, Dermacentor pictus, Dermacentor albipictus, Dermacentor andersoni, Dermacentor variabilis, Hyalomma mauritanicum, Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus bursa, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus capensis, Rhipicephalus turanicus, Rhipicephalus zambeziensis, Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Amblyomma maculatum, Amblyomma hebraeum, Amblyomma cajennense, Dermanyssus gallinae, Ornithonyssus bursa, Ornithonyssus sylvianum, Varroa jacobsoni;

Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletiella spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp.; spezielle Beispiele sind: Cheyletiella yasguri, Cheyletiella blakei, Demodex canis, Demodex bovis, Demodex ovis, Demodex caprae, Demodex equi, Demodex caballi, Demodex suis, Neotrombicula autumnalis, Neotrombicula desalerei, Neoschöngastia xerothermobia, Trombicula akamushi, Otodectes cynotis, Notoedres cati, Sarcoptes canis, Sarcoptes bovis, Sarcoptes ovis, Sarcoptes rupicaprae (=S. caprae), Sarcoptes equi, Sarcoptes suis, Psoroptes ovis, Psoroptes cuniculi, Psoroptes equi, Chorioptes bovis, Psorergates ovis, Pneumonyssoides mange, Pneumonyssoides caninum, Acarapis woodi.

**[0166]** Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, Helminthen und Protozoen, die Tiere befallen. Zu den Tieren zählen landwirtschaftliche Nutztiere wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Zuchtfische, Honigbienen. Zu den Tieren zählen außerdem Haustiere - die auch als Heimtiere bezeichnet werden - wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse.

**[0167]** Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden, Helminthen und/oder Protozoen sollen Todesfälle vermindert und die Leistung (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) und die Gesundheit des Wirtstieres verbessert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

**[0168]** So ist es beispielsweise wünschenswert, die Aufnahme von Blut des Wirts durch die Parasiten (falls zutreffend) zu verhindern oder zu unterbrechen. Eine Bekämpfung der Parasiten kann außerdem dazu beitragen, die Übertragung infektiöser Substanzen zu verhindern.

**[0169]** Der Begriff "Bekämpfung", so wie er hier bezogen auf den Bereich Tiergesundheit verwendet wird, bedeutet, dass die Wirkstoffe wirken, indem sie das Vorkommen des betreffenden Parasiten in einem mit solchen Parasiten befallenen Tier auf unschädliche Niveaus reduzieren. Genauer gesagt bedeutet "Bekämpfung", wie hier verwendet, dass der Wirkstoff den betreffenden Parasiten tötet, sein Wachstum hemmt oder seine Proliferation inhibiert.

**[0170]** Im allgemeinen können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe, wenn sie für die Behandlung von Tieren eingesetzt werden, direkt angewendet werden. Vorzugsweise werden sie als pharmazeutische Zusammensetzungen angewendet, die im Stand der Technik bekannte pharmazeutisch unbedenkliche Exzipienten und/oder Hilfsstoffe enthalten können.

**[0171]** Die Anwendung (= Verabreichung) der Wirkstoffe im Bereich Tiergesundheit und in der Tierhaltung erfolgt in

bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subkutan, intravenös, intraperitoneal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Applikation in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw. Die Wirkstoffe können als Shampoo oder als geeignete, in Aerosolen oder drucklosen Sprays, z.B. Pumpsprays und Zerstäubersprays, anwendbare, Formulierungen formuliert werden.

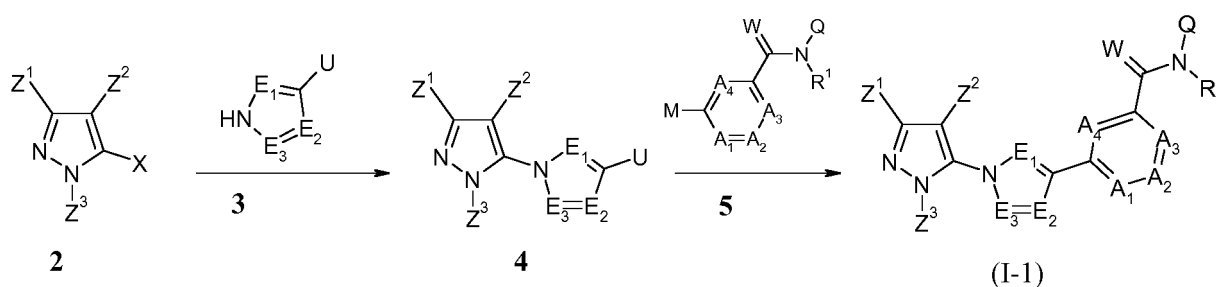
**[0172]** Bei der Anwendung für Nutztiere, Geflügel, Haustiere etc. kann man die erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Spritzpulver [wetable powders, "WP"], Emulsionen, Emulsionskonzentrate [emulsifiable concentrates, "EC"], fließfähige Mittel, homogene Lösungen und Suspensionskonzentrate [suspension concentrates, "SC"]), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach Verdünnung (z.B. 100- bis 10 000facher Verdünnung) anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

**[0173]** Beim Einsatz im Bereich Tiergesundheit können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Kombination mit geeigneten Synergisten oder anderen Wirkstoffen wie beispielsweise Akariziden, Insektiziden, Anthelmintika, Mittel gegen Protozoen, verwendet werden.

**[0174]** Die erfindungsgemäßen Verbindungen können nach üblichen, dem Fachmann bekannten Methoden hergestellt werden.

**[0175]** Im Reaktionsschema 1 ist das allgemeine Darstellungsverfahren A für die erfindungsgemäßen Verbindungen (I-1) abgebildet.

### Reaktionsschema 1

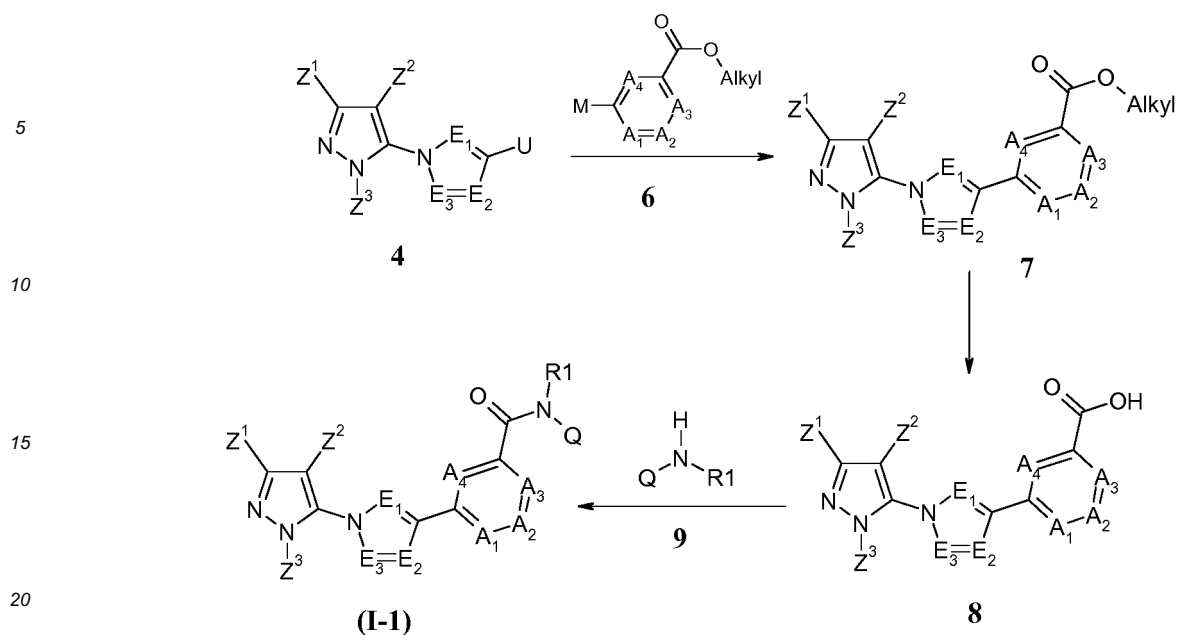


**[0176]** Die Reste A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, Q, W, R<sup>1</sup> und Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> haben die oben beschriebenen Bedeutungen. Die fünfgliedrigen Zyklen aus E<sub>1</sub>-E<sub>3</sub>, Kohlenstoff und Stickstoff stehen für die unter T definierten 5 gliedrigen Heterozyklen. X steht für ein Halogen. U steht für Brom, Iod oder Triflat, wenn M für eine Boronsäure, Boronsäureester oder Trifluorboronat steht. U steht für eine Boronsäure, Boronsäureester oder Trifluorboronat, wenn M für Brom, Iod oder Triflat steht.

**[0177]** Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Struktur (I-1) können nach literaturbekannten Verfahren mittels Palladium katalysierten Reaktionen aus den Reaktionspartnern 4 und 5 hergestellt werden [WO2005-040110; WO2009-089508]. Die Verbindungen der allgemeinen Struktur 5 sind entweder kommerziell erhältlich oder können nach dem Fachmann bekannten Verfahren hergestellt werden. Die Verbindungen der allgemeinen Struktur 4 lassen sich nach literaturbekannten Verfahren entweder durch eine nucleophile Substitution am Aromaten (X = Chlor oder Fluor) [WO2007-107470; Tetrahedron Letters 2003, 44, 7629-7632] oder durch eine Übergangsmetall katalysierte Reaktion (X = Brom oder Iod) [WO2012-003405; WO2009-158371] aus den entsprechenden Ausgangsmaterialien 2 und 3 herstellen.

**[0178]** Alternativ können die erfindungsgemäßen Verbindungen (I-a) durch das allgemeine Darstellungsverfahren B (Reaktionsschema 2) dargestellt werden.

### Reaktionsschema 2

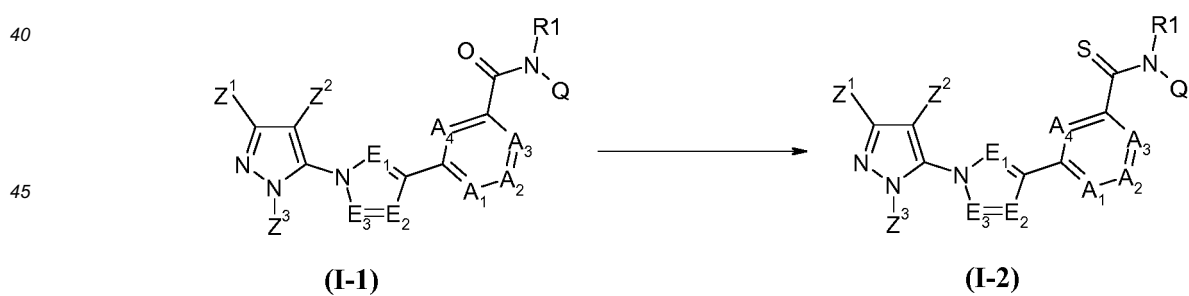


**[0179]** Die Reste  $A_1$ - $A_4$ ,  $Q$ ,  $R^1$  und  $Z^1$ - $Z^3$  haben die oben beschriebenen Bedeutungen. Die fünfgliedrigen Zyklen aus  $E_1$ - $E_3$ , Kohlenstoff und Stickstoff stehen für die unter T definierten 5 gliedrigen Heterozyklen. U steht für Brom, Iod oder Triflat, wenn M für eine Boronsäure, Boronsäureester oder Trifluorboronat steht. U steht für eine Boronsäure, Boronsäureester oder Trifluorboronat, wenn M für Brom, Iod oder Triflat steht.

**[0180]** Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Struktur (I-1) können in Analogie zu literaturbekannten Peptidkupplungsmethoden aus den Ausgangsmaterialien **8** und **9** hergestellt werden [WO2010-051926; WO2010-133312]. Verbindungen der allgemeinen Struktur **8** lassen sich in Analogie zu literaturbekannten Verfahren durch Esterspaltung aus Verbindungen der allgemeinen Struktur **7** herstellen [WO2010-051926; WO2010-133312]. Verbindungen der allgemeinen Struktur **7** können in Analogie zur literaturbekannten Verfahren mittels Palladium katalysierten Reaktionen hergestellt werden [WO2005-040110; WO2009-089508].

**[0181]** Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Struktur (1-2) lassen sich nach dem in Reaktionsschema 3 dargestellten Darstellungsverfahren C synthetisieren.

### Reaktionsschema 3

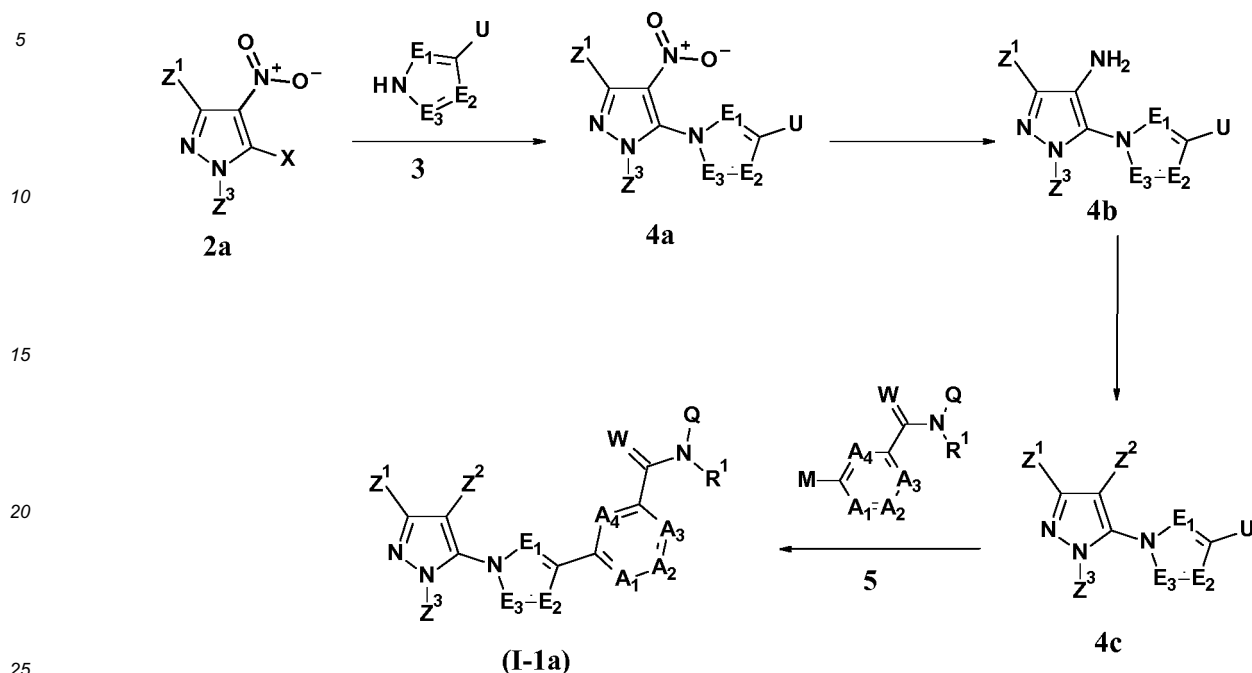


**[0182]** Die Reste  $A_1$ - $A_4$ ,  $Q$ ,  $R^1$  und  $Z^1$ - $Z^3$  haben die oben beschriebenen Bedeutungen. Die fünfgliedrigen Zyklen aus  $E_1$ - $E_3$ , Kohlenstoff und Stickstoff stehen für die unter T definierten 5 gliedrigen Heterozyklen.

**[0183]** Erfindungsgemäße Strukturen der allgemeinen Struktur (1-2) lassen sich in Analogie zu literaturbekannten Verfahren aus Verbindungen der allgemeinen Struktur (I-1) darstellen [WO2012-056372; WO2003-066050].

**[0184]** Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Struktur (I-1a) lassen sich nach dem in Reaktionsschema 4 dargestellten Darstellungsverfahren D synthetisieren.

## Reaktionsschema 4



[0185] Die Reste  $A_1$ - $A_4$ , Q, W,  $R^1$ ,  $Z^1$  und  $Z^3$  haben die oben beschriebenen Bedeutungen.  $Z^2$  steht für Reste wie Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methylsulfanyl, Hydroxy und anderen Resten die via Diazoniumsalz von 4b hergestellt werden können [Chemical Reviews 1988, 88, 5, 765-792]. Die fünfgliedrigen Zyklen aus E1-E3, Kohlenstoff und Stickstoff stehen für die unter T definierten 5 gliedrigen Heterozyklen. X steht für ein Halogen. U steht für Brom, Iod oder Triflat, und M steht für eine Boronsäure, Boronsäureester oder Trifluorboronat.

[0186] Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Struktur (I-1a) können nach literaturbekannten Verfahren mittels Palladium katalysierten Reaktionen aus den Reaktionspartnern 4c und 5 hergestellt werden [WO2005-040110; WO2009-089508]. Die Verbindungen der allgemeinen Struktur 5 sind entweder kommerziell erhältlich oder können nach dem Fachmann bekannten Verfahren hergestellt werden. Die Verbindungen der allgemeinen Struktur 4c lassen sich nach literaturbekannten Verfahren aus den Verbindungen der allgemeinen Struktur 4b herstellen [Chemical Reviews 1988, 88, 5, 765-792]. Verbindungen der allgemeinen Struktur 4b können aus Verbindungen der allgemeinen Struktur 4a nach literaturbekannten Verfahren hergestellt werden [WO2008-008375; Journal of Heterocyclic Chemistry 2002, 39(5), 1055-1059]. Die Verbindungen der allgemeinen Struktur 4a lassen sich nach literaturbekannten Verfahren entweder durch eine nucleophile Substitution am Aromaten (X = Chlor oder Fluor) [WO2007-107470; Tetrahedron Letters 2003, 44, 7629-7632] oder durch eine Übergangsmetall katalysierte Reaktion (X = Brom oder Iod) [WO2012-003405; WO2009-158371] aus den entsprechenden Ausgangsmaterialien 2a und 3 herstellen.

[0187] Die Verbindungen der allgemeinen Struktur 5 sind entweder kommerziell erhältlich oder können nach dem Fachmann bekannten Verfahren bzw. in Analogie zu diesen Verfahren hergestellt werden [WO2012004217; WO2009-130475; WO2008-107125; WO2003-099805; WO2012-0225061; WO2009-010488].

[0188] Die Verbindungen der allgemeinen Struktur 2/2a sind entweder kommerziell erhältlich oder können nach dem Fachmann bekannten Verfahren bzw. in Analogie zu diesen Verfahren hergestellt werden [WO2010-051926; WO2011-131615; WO2006-018725; WO2012-065932; WO2007077961; US2012-0115903; WO2010-017902; WO2010-127856; Tetrahedron Letters 2011, 44, 8451-8457]

[0189] Die Verbindungen der allgemeinen Struktur 3 sind entweder kommerziell erhältlich oder können nach dem Fachmann bekannten Verfahren bzw. in Analogie zu diesen Verfahren hergestellt werden.

[0190] Oxidationsmittel für die Oxidation alkoholischer Gruppen sind bekannt (vgl. z. B. Oxidationsreagenzien in Organic Synthesis by Oxidation with Metal Compounds, Mijs, de Jonge, Plenum Verlag, New York, 1986; Manganese Compounds as Oxidizing Agents in Organic Chemistry, Arndt, Open Court Publishing Company, La Salle, IL, 1981; The Oxidation of Organic Compounds by Permanganate Ion and Hexavalent Chromium, Lee, Open Court Publishing Company, La Salle, IL, 1980). Eine Oxidation kann beispielsweise in Gegenwart von Permanganaten (z.B. Kaliumpermanganat), Metalloxiden (z.B. Mangandioxid, Chromoxide die beispielsweise in Dipyridin-chrom(VI)-oxid als Collins Reagenz (vgl. J. C. Collins et al., Tetrahedron Lett. 30, 3363-3366, 1968) verwendet werden) durchgeführt werden. Ebenfalls in

Gegenwart von Pyridiniumchlorochromat (z.B. Corey's Reagenz) (vgl. auch R. O. Hutchins et al., Tetrahedron Lett. 48, 4167-4170, 1977; D. Landini et al. Synthesis 134-136, 1979) oder Ruthenium-tetroxid (vgl. S.-I. Murahashi, N. Komiya Ruthenium-catalyzed Oxidation of Alkenes, Alcohols, Amines, Amides,  $\beta$ -Lactams, Phenols and Hydrocarbons, in: Modern Oxidation Methods, Baekvall, Jan-Erling (Eds.), Wiley-VCH-Verlag GmbH & Co. KGaA, 2004). Ebenfalls geeignet sind Ultraschall-induzierte Oxidationsreaktionen, sowie die Verwendung von Kaliumpermanganat (vgl. J. Yamawaki et al., Chem. Lett. 3, 379-380, 1983).

**[0191]** Zur Deblockierung/Abspaltung der Schutzgruppe SG können alle bekannten geeigneten sauren oder basischen Reaktionshilfsmittel nach den in der Literatur beschriebenen Verfahrensweisen verwendet werden. Bei Verwendung von Schutzgruppen für Aminogruppen des Carbamat-Typs werden bevorzugt saure Reaktionshilfsmittel verwendet. Bei Verwendung der *t*-Butylcarbamat-Schutzgruppe (BOC-Gruppe) werden beispielsweise Mischungen von Mineralsäuren wie Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder organischen Säuren wie Benzoesäure, Ameisensäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure, Methansulfonsäure, Benzolsulfonsäure oder Toluolsulfonsäure und einem geeigneten Verdünnungsmittel wie Wasser und/oder einem organischen Lösungsmittel wie Tetrahydrofuran, Dioxan, Dichlormethan, Chloroform, Essigester, Ethanol oder Methanol verwendet. Bevorzugt sind Mischungen von Salzsäure oder Essigsäure mit Wasser und/oder einem organischen Lösungsmittel wie Essigester.

**[0192]** Es ist bekannt, dass manche Reaktionen und Herstellungsverfahren besonders gut in Gegenwart von Verdünnungs- bzw. Lösungsmittel und basischer oder saurer Reaktionshilfsmitteln durchführbar sind. Mischungen der Verdünnungs- bzw. Lösungsmittel sind ebenfalls einsetzbar. Die Verdünnungs- bzw. Lösungsmittel werden vorteilhafterweise in einer solchen Menge eingesetzt, dass das Reaktionsgemisch während des ganzen Verfahrens gut rührbar ist.

**[0193]** Als Verdünnungs- bzw. Lösungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren kommen grundsätzlich alle unter den spezifischen Reaktionsbedingungen inerten organischen Lösungsmittel in Frage. Als Beispiele sind zu nennen: Halogenkohlenwasserstoffe (z.B. Chlorkohlenwasserstoffe, wie Tetraethylen, Tetrachlorethan, Dichlorpropan, Methylenchlorid, Dichlorbutan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Trichlorethan, Trichlorethylen, Pentachlorethan, Difluorbenzol, 1,2-Dichlorethan, Chlorbenzol, Brombenzol, Dichlorbenzol, Chlortoluol, Trichlorbenzol), Alkohole (z.B. Methanol, Ethanol, Isopropanol, Butanol), Ether (z.B. Ethylpropylether, Methyl-*t*-butylether, *n*-Butylether, Anisol, Phenetol, Cyclohexylmethylether, Dimethylether, Diethylether, Dipropylether, Diisopropylether, Di-*n*-butylether, Diisobutylether, Diisoamylether, Ethylenglycoldimethylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Dichlordiethylether und Polyether des Ethylenoxids und/oder Propylenoxids), Amine (z.B. Trimethyl-, Triethyl-, Tripropyl-, Tributylamin, *N*-Methylmorpholin, Pyridin und Tetramethyldiamin), Nitrokohlenwasserstoffe (z.B. Nitromethan, Nitroethan, Nitropropan, Nitrobenzol, Chlornitrobenzol, *o*-Nitrotoluol; Nitrile wie Acetonitril, Propionitril, Butyronitril, Isobutyronitril, Benzonnitril, *m*-Chlorbenzonnitril), Tetrahydrothiophendioxid, Dimethylsulfoxid, Tetramethylsulfoxid, Dipropylsulfoxid, Benzylmethylsulfoxid, Diisobutylsulfoxid, Dibutylsulfoxid, Diisoamylsulfoxid, Sulfone (z.B. Dimethyl-, Diethyl-, Dipropyl-, Dibutyl-, Diphenyl-, Dihexyl-, Methylethyl-, Ethylpropyl-, Ethylisobutyl- und Pentamethylsulfon), aliphatische, cycloaliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe (z.B. Pentan, Hexan, Heptan, Octan, Nonan und technische Kohlenwasserstoffe), ferner sogenannte "White Spirits" mit Komponenten mit Siedepunkten im Bereich von beispielsweise 40°C bis 250°C, Cymol, Benzinfraktionen innerhalb eines Siedeinterwales von 70°C bis 190°C, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Petrolether, Ligroin, Octan, Benzol, Toluol, Chlorbenzol, Brombenzol, Nitrobenzol, Xylol, Ester (z.B. Methyl-, Ethyl-, Butyl-, Isobutylacetat, Dimethyl-, Dibutyl-, Ethylencarbonat); Amide (z.B. Hexamethylenphosphorsäuretriamid, Formamid, *N*-Methylformamid, *N,N*-Dimethylformamid, *N,N*-Dipropylformamid, *N,N*-Dibutylformamid, *N*-Methylpyrrolidin, *N*-Methylcaprolactam, 1,3-Dimethyl-3,4,5,6-tetrahydro-2(1H)-pyrimidin, Octylpyrrolidon, Octylcaprolactam, 1,3-Dimethyl-2-imidazolindion, *N*-Formylpiperidin, *N,N'*-1,4-Diformylpiperazin) und Ketone (z.B. Aceton, Acetophenon, Methylethylketon, Methylbutylketon).

**[0194]** Als basische Reaktionshilfsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren können alle geeigneten Säurebindemittel eingesetzt werden. Als Beispiele sind zu nennen: Erdalkali- oder Alkalimetallverbindungen (z.B. Hydroxide, Hydride, Oxide und Carbonate des Lithiums, Na-triums, Kaliums, Magnesiums, Calciums und Bariums), Amidinbasen oder Guanidinbasen (z.B. 7-Methyl-1,5,7-triaza-bicyclo(4.4.0)dec-5-en (MTBD); Diazabicyclo(4.3.0)nonen (DBN), Diazabicyclo(2.2.2)octan (DABCO), 1,8-Diazabicyclo(5.4.0)undecen (DBU), Cyclohexyltetra-butyl-guanidin (CyTBG), Cyclohexyltetramethylguanidin (CyTMG), *N,N,N,N*-Tetramethyl-1,8-naphthalindiamin, Pentamethylpiperidin) und Amine, insbesondere tertiäre Amine, (z.B. Triethylamin, Trimethylamin, Tribenzylamin, Triisopropylamin, Tributylamin, Tricyclohexylamin, Triamylamin, Trihexylamin, *N,N*-Dimethylanilin, *N,N*-Dimethyltoluidin, *N,N*-Dimethyl-*p*-aminopyridin, *N*-Methylpyrrolidin, *N*-Methylpiperidin, *N*-Methylimidazol, *N*-Methylpyrazol, *N*-Methylmorpholin, *N*-Methylhexamethyldiamin, Pyridin, 4-Pyrrolidinopyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, Chinolin,  $\alpha$ -Picolin,  $\beta$ -Picolin, Isochinolin, Pyrimidin, Acridin, *N,N,N,N'*-Tetramethyldiamin, *N,N,N,N'*-Tetraethyldiamin, Chinoxalin, *N*-Propyl-diisopropylamin, *N*-Ethyl-diisopropylamin, *N,N'*-Dimethylcyclohexylamin, 2,6-Lutidin, 2,4-Lutidin oder Triethyldiamin).

**[0195]** Als saure Reaktionshilfsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren können alle Mineralsäuren (z.B. Halogenwasserstoff-säuren wie Fluorwasserstoffsäure, Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure oder Iodwasserstoffsäure sowie Schwefelsäure, Phosphorsäure, Phosphorige Säure, Salpetersäure), Lewis Säuren (z.B. Aluminium(III)-chlorid, Bortrifluorid oder sein Etherat, Titan(V)-chlorid, Zinn(V)-chlorid, und organische Säuren (z.B. Amei-

ensäure, Essigsäure, Propionsäure, Malonsäure, Milchsäure, Oxalsäure, Fumarsäure, Adipinsäure, Stearinsäure, Weinsäure, Ölsäure, Methansulfonsäure, Benzoessäure, Benzolsulfonsäure oder para-Toluolsulfonsäure eingesetzt werden.

**[0196]** Sofern in den Reaktionsschemata Schutzgruppen vorgesehen sind, können alle allgemein bekannten Schutzgruppen verwendet werden. Insbesondere solche, die von Greene T. W., Wuts P. G. W. in *Protective Groups in Organic Synthesis*; John Wiley & Sons, Inc. 1999, "Protection for the hydroxyl group including 1,2- and 1,3-diols" beschrieben sind.

Weiterhin eignen sich auch Schutzgruppen

**[0197]** vom Typ eines substituierten Methylethers (z.B. Methoxymethylether (MOM), Methylthiomethylether (MTM), (Phenyl-dimethylsilyl)methoxymethylether (SNOM-OR), Benzylloxymethylether (BOM-OR) para-Methoxybenzylloxymethylether (PMBM-OR), para-Nitrobenzylloxymethyl-ether, ortho-Nitrobenzylloxymethylether (NBOM-OR), (4-Methoxyphenoxy)-methylether (p-AOM-OR), Guaiacolumethylether (GUM-OR), t-Butoxymethylether, 4-Pentyloxy-methylether (POM-OR), Silyloxymethylether, 2-Methoxy-ethoxy-methylether (MEM-OR), 2,2,2-Trichlorethoxymethylether, Bis(2-chlorethoxy)-methylether, 2-(Trimethyl-silyl)ethoxymethylether (SEM-OR), Methoxymethylether (MM-OR));

vom Typ eines substituierten Ethylethers (z.B. 1-Ethoxyethylether (EE-OR), 1-(2-Chlorethoxy)ethylether (CEE-OR), 1-[2-(Trimethylsilyl)ethoxy]ethylether (SEE-OR), 1-Methyl-1-methoxyethylether (MIP-OR), 1-Methyl-1-benzyloxyethylether (MBE-OR), 1-Methyl-1-benzyloxy-2-fluor-ethylether (MIP-OR), 1-Methyl-1-phenoxyethylether, 2,2,-Trichlorethylether, 1,1-Dianisyl-2,2-trichlorethylether (DATE-OR), 1,1,1,3,3,3-Hexafluor-2-phenylisopropylether (HIP-OR), 2-Trimethylsilylethylether, 2-(Benzylthio)ethylether, 2-(Phenylselenyl)ethylether), eines Ethers (z.B. Tetrahydropyranylether (THP-OR), 3-Brom-tetrahydropyranylether (3-BrTHP-OR), Tetrahydrothiopyranylether, 1-Methoxy-cyclohexylether, 2- und 4-Picolylether, 3-Methyl-2-picolyl-N-oxido-ether, 2-Quinolinylmethylether (Qm-OR), 1-Pyrenylmethylether, Dipenylmethylether (DPM-OR), para'-Dinitrobenzhydrylether (DNB-OR), 5-Dibenzosuberylether, Triphenylmethylether (Tr-OR), alpha-Naphthylidiphenylmethylether, para-Methoxy-phenyldiphenylmethylether (MMTrOR), Di(para-methoxyphenyl)phenylmethylether (DMTr-OR), Tri(para-methoxy-phenyl)phenylmethylether (TMTr-OR), 4-(4'-Brom-phenacyloxy) phenyldiphenylmethylether, 4,4',4"-Tris(4,5-dichlorphthalimido-phenyl)methylether (CPTr-OR), 4,4',4"-Tris(benzoyloxyphenyl)-methylether (TBTr-OR), 4,4'-Dimethoxy-3"-[N-(imidazolylmethyl)]-tritylether (IDTr-OR), 4,4'-Dimethoxy-3"-[N-(imidazolylethyl)carbamoyl]tritylether (IETr-OR), 1,1-Bis(4-methoxy-phenyl)-1'-pyrenyl-methylether (Bmpm-OR), 9-Anthrylether, 9-(9-Phenyl)xanthenylether (Pixyl-OR), 9-(9-Phenyl-10-oxo)anthryl (Tritylon-Ether), 4-Methoxy-tetrahydropyranylether (MTHP-OR), 4-Methoxy-tetrahydrothiopyranylether, 4-Methoxy-tetrahydrothiopyranyl-S,S-dioxid, 1-[(2-Chlor-4-methyl)phenyl]-4-methoxypiperidin-4-yl-ether (CTMP-OR), 1-(2-Fluorphenyl)-4-methoxy-piperidin-4-yl-ether (Fpmp-OR), 1,4-Dioxan-2-yl-ether, Tetrahydrofuranylether, Tetrahydrothiofuranylether, 2,3,3a,4,5,6,7,7a-Octahydro-7,8,8-trimethyl-4,7-methanbenzofuran-2-yl-ether (MBF-OR), t-Butylether, Allylether, Propargylether, para-Chlorphenylether, para-Methoxy-phenylether, para-Nitro-phenylether, para-2,4-Dinitro-phenylether (DNP-OR), 2,3,5,6-Tetrafluor-4-(trifluormethyl)phenylether, Benzylether (Bn-OR));

vom Typ eines substituierten Benzylethers (z.B. para-Methoxy-benzylether (MPM-OR), 3,4-Dimethoxybenzylether (DMPM-OR), ortho-Nitro-benzylether, para-Nitro-benzylether, para-Halo-benzylether, 2,6-Dichlor-benzylether, para-Aminoacyl-benzylether (PAB-OR), para-Azido-benzylether (Azb-OR), 4-Azido-3-chlor-benzylether, 2-Trifluormethylbenzylether, para-(Methylsulfinyl)benzylether (Msib-OR));

vom Typ eines Silylethers (z.B. Trimethylsilylether (TMS-OR), Triethylsilylether (TES-OR), Triisopropylsilylether (TIPS-OR), Dimethylisopropylsilylether (IPDMS-OR), Diethylisopropylsilylether (DEIPS-OR), Dimethylhexylsilylether (TDS-OR), t-Butyldimethylsilylether (TBDMS-OR), t-Butyldiphenylsilylether (TBDPS-OR), Tribenzylsilylether, Tri-para-xylylsilylether, Triphenylsilylether (TPS-OR), Diphenylmethylsilylether (DPMS-OR), Di-t-butylmethylsilylether (DTBMS-OR), Tris(trimethylsilyl)silylether (Sisylether), Di-t-butylmethylsilylether (DTBMS-OR), Tris(trimethylsilyl)silylether (Sisylether), (2-Hydroxystyryl)-dimethylsilylether (HSDMS-OR), (2-Hydroxystyryl)diisopropylsilylether (HSDIS-OR), t-Butylmethoxyphenyl-silylether (TBMPs-OR), t-Butoxydiphenylsilylether (DPTBOS-OR));

vom Typ eines Esters (z.B. Formiatester, Benzoylformiatester, Acetatester (Ac-OR), Chloracetatester, Dichloracetatester, Trichloracetatester, Trifluoracetatester, (TFA-OR), Methoxyacetatester, Triphenylmethoxyacetatester, Phenoxyacetatester, para-Chlor- phenoxyacetatester, Phenylacetatester, Diphenylacetatester (DPA-OR), Nicotinatester, 3-Phenyl-propionatester, 4-Pentoatester, 4-Oxopentoatester (Levulinate) (Lev-OR) 4,4-(Ethylendithio)-pentanoatester (LevS-OR), 5-[3-Bis(4-methoxyphenyl)hydroxy-methoxyphenoxy]-levulinatester, Pivaloatester (Pv-OR), 1-Adamantanoatester, Crotonatester, 4-Methoxy-crotonatester, Benzoatester (Bz-OR), para-Phenyl-benzoatester, 2,4,6-Trimethyl-benzoatester (Mesitoate), 4-(Methylthiomethoxy)-butyratester (MTMB-OR), 2-(Methylthiomethoxymethyl)-benzoatester (MTMT-OR),

vom Typ eines Esters (z.B. Methylcarbonat, Methoxymethylcarbonat, 9-Fluorenylmethylcarbonat (Fmoc-OR), Ethylcarbonat, 2,2,2-Trichlorethylcarbonat (Troc-OR), 1,1-Dimethyl-2,2,2-trichlorethylcarbonat (TCBOC-OR), 2-(Trimethylsilyl)ethylcarbonat (TMS-OR), 2-(Phenylsulfonyl)-ethylcarbonat (Ps-OR), 2-(Triphenylphosphonio)-ethylcarbonat (Peoc-OR), t-Butylcarbonat (Boc-OR), Isobutylcarbonat, Vinylcarbonat, Allylcarbonat (Alloc-OR), para-Nitro-phenylcarbonat,

Benzylcarbonat (Z-OR), para-Methoxy-benzylcarbonat, 3,4-Dimethoxy-benzylcarbonat, ortho-Nitro-benzylcarbonat, para-Nitro-benzylcarbonat, 2-Dansylethylcarbonat (Dnseoc-OR), 2-(4-Nitrophenyl)ethylcarbonat (Npeoc-OR), 2-(2,4-Dinitrophenyl)ethylcarbonat (Dnpeoc)), und

vom Typ eines Sulfats (z.B. Allylsulfonat (Als-OR), Methansulfonat (Ms-OR), Benzylsulfonat, Tosylat (Ts-OR), 2-[(4-Nitrophenyl)ethyl]sulfonat (Npes-OR)).

**[0198]** Als Katalysatoren zur Durchführung einer katalytischen Hydrierung im erfindungsgemäßen Verfahren sind alle üblichen Hydrierkatalysatoren, wie beispielsweise Platin-Katalysatoren (z.B. Platin-Platte, Platin-Schwamm, Platin-Schwarz, kolloidales Platin, Platinoxid, Platindraht), Palladium-Katalysatoren (z.B. Palladium-Schwamm, Palladium-Schwarz, Palladiumoxid, Palladium-Kohle, kolloidales Palladium, Palladium-Bariumsulfat, Palladium-Bariumcarbonat, Palladium-Hydroxid), Nickelkatalysatoren (z.B. reduziertes Nickel, Nickeloxid, Raney-Nickel), Ruthenium-Katalysatoren, Cobalt-Katalysatoren (z.B. reduziertes Cobalt, Raney-Cobalt), Kupfer-Katalysatoren (z.B. reduziertes Kupfer, Raney-Kupfer, Ullmann-Kupfer) geeignet. Bevorzugt werden Edelmetallkatalysatoren (z.B. Platin- und Palladium- oder Ruthenium-Katalysatoren) verwendet, die gegebenenfalls auf einem geeigneten Träger (z.B. Kohlenstoff oder Silizium) aufgebraucht sind, Rhodium-Katalysatoren (z.B. Tris(triphenylphosphin)rhodium(I)-chlorid in Gegenwart von Triphenylphosphin). Ferner können "chiralen Hydrierkatalysatoren" (z. B. solche die chirale Diphosphinliganden enthalten wie (2S,3S)-(-)-2,3-Bis(diphenylphosphino)-butan [(S,S)-Chiraphos] oder (R)-(+)-2,2'- bzw. (S)-(-)-2,2'-Bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthalin [R(+)-BINAP bzw. S(-)-BINAP]) verwendet werden, wodurch der Anteil eines Isomers im Isomerenmisch erhöht wird bzw. das Entstehen eines anderen Isomers nahezu vollständig unterdrückt wird.

**[0199]** Die Herstellung von Salzen der erfindungsgemäßen Verbindungen erfolgt nach Standardverfahren. Repräsentative Säureadditionssalze sind beispielsweise solche die durch Reaktion mit anorganischen Säuren, wie beispielsweise Schwefelsäure, Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäure oder organischen Carbonsäuren wie Essigsäure, Trifluoressigsäure, Zitronensäure, Bernsteinsäure, Buttersäure, Milchsäure, Ameisensäure, Fumarsäure, Maleinsäure, Malonsäure, Camphersäure, Oxalsäure, Phthalsäure, Propionsäure, Glycolsäure, Glutarsäure, Stearinsäure, Salicylsäure, Sorbinsäure, Weinsäure, Zimtsäure, Valeriansäure, Pikrinsäure, Benzoesäure oder organischen Sulfonsäuren wie Methansulfonsäure und 4-Toluolsulfonsäure gebildet werden.

**[0200]** Repräsentativ sind auch Salze von erfindungsgemäßen Verbindungen, die aus organischen Basen, wie beispielsweise Pyridin oder Triethylamine gebildet werden oder solche, die aus anorganischen Basen, wie beispielsweise Hydride, Hydroxide oder Karbonate des Natriums, Lithiums, Calciums, Magnesiums oder Bariums, gebildet werden, wenn die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) ein zu dieser Salzbildung geeignetes Strukturelement aufweist.

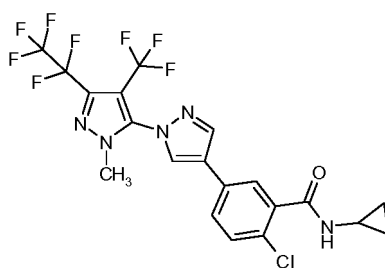
**[0201]** Synthesemethoden zur Darstellung heterocyclischer N-Oxide und t-Aminen sind bekannt. Sie können mit Peroxysäuren (z.B. Peressigsäure und meta-Chlor-perbenzoesäure (MCPBA), Wasserstoffperoxid), Alkylhydroperoxide (z.B. t-Butylhydroperoxid), Natriumperborat und Dioxirane (z.B. Dimethyldioxiran) erhalten werden. Diese Methoden sind beispielsweise von T. L. Gilchrist, in *Comprehensive Organic Synthesis*, Vol. 7, S. 748-750, 1992, S. V. Ley, (Ed.), Pergamon Press; M. Tisler, B. Stanovnik, in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 3, S. 18-20, 1984, A. J. Boulton, A. McKillop, (Eds.), Pergamon Press; M. R. Grimmett, B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 43, S. 149-163, 1988, A. R. Katritzky, (Ed.), Academic Press; M. Tisler, B. Stanovnik, in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 9, S. 285-291, 1968, A. R. Katritzky, A. J. Boulton (Eds.), Academic Press; G. W. H. Cheeseman, E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 22, S. 390-392, 1978, A. R. Katritzky, A. J. Boulton, (Eds.), Academic Press beschrieben.

## Experimenteller Teil

### Darstellungsverfahren A

Beispiel (Ic-1) 2-Chlor-N-cyclopropyl-5-[2'-methyl-5'-(pentafluorethyl)-4'-(trifluormethyl)-2'H-1,3'-bipyrazol-4-yl]benzamid

### [0202]



## EP 2 953 942 B1

**[0203]** 2,00 g (6,99 mmol) 5-Fluor-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol, 1,03 g (6,99 mmol) 4-Brom-1H-pyrazol und 1,93 g Kaliumcarbonat werden in 50 mL Tetrahydrofuran p.a. suspendiert. Die Reaktionsmischung wird 16h unter Rückfluß erhitzt. Das abgekühlte Reaktionsgemisch wird filtriert und das Lösungsmittel unter vermindertem Druck entfernt. Der Rückstand wird säulenchromatographisch an Kieselgel aufgereinigt.

**[0204]** Man erhält 0,69 g 4-Brom-2'-methyl-5'-(pentafluorethyl)-4'-(trifluormethyl)-2'H-1,3'-bipyrazol als farblosen Feststoff.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{d}_3$ -Acetonitril):  $\delta = 8,00$  (s, 1H), 7,91 (s, 1H), 3,71 (s, 3H).

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 4,14, Masse (m/z) = 413 [M+H]<sup>+</sup>.

**[0205]** 150 mg (0,36 mmol) 4-Brom-2'-methyl-5'-(pentafluorethyl)-4'-(trifluormethyl)-2'H-1,3'-bipyrazol, 87 mg (0,36 mmol) [4-Chlor-3-(cyclopropylcarbamoyl)phenyl]boronsäure, 21 mg (0,01 mmol) Tetrakis(triphenylphosphin)palladium und 1,1 mL einer 1M wässrigen Natriumhydrogencarbonat Lösung werden mit 10,5 mL Isopropylalkohol versetzt und 3h unter Rückfluß erhitzt. Die Reaktionsmischung wird bis zur Trockene eingengt und der Rückstand in Ethylacetat aufgenommen. Die organische Phase wird zweimal mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und bis zur Trockene eingengt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

**[0206]** Man erhält 71 mg 2-Chlor-N-cyclopropyl-5-[2'-methyl-5'-(pentafluorethyl)-4'-(trifluormethyl)-2'H-1,3'-bipyrazol-4-yl]benzamid als farblosen Feststoff.

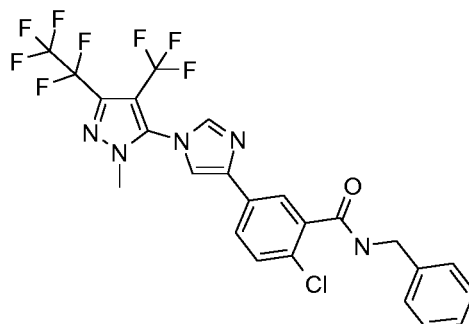
$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{d}_3$ -Acetonitril):  $\delta = 8,26$  (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,65 (dd, 1H), 7,48 (d, 1H), 6,95 (s, 1H), 3,75 (s, 3H), 2,82-2,87 (m, 1H), 0,75-0,80 (m, 2H), 0,57-0,62 (m, 2H).

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 3,79, Masse (m/z) = 528 [M+H]<sup>+</sup>.

### Darstellungsverfahren B

Beispiel (Ib1) N-Benzyl-2-chlor-5-{1-[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]-1H-imidazol-4-yl}benzamid

**[0207]**



**[0208]** 500 mg (1,74 mmol) 5-Fluor-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol, 339 mg (1,74 mmol) 4-Iod-1H-imidazol und 483 mg (3,49 mmol) Kaliumcarbonat werden in 20 mL Tetrahydrofuran p.a. suspendiert. Die Reaktionsmischung wird bis zur vollständigen Umsetzung unter Rückfluß erhitzt. Das abgekühlte Reaktionsgemisch wird filtriert und das Lösungsmittel unter vermindertem Druck entfernt. Der Rückstand wird säulenchromatographisch an Kieselgel aufgereinigt.

**[0209]** Man erhält 370 mg 5-(4-Iod-1H-imidazol-1-yl)-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol als farblosen Feststoff.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{d}_3$ -Acetonitril):  $\delta = 7,68$  (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 3,68 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 3,47, Masse (m/z) = 461 [M+H]<sup>+</sup>.

**[0210]** 250 mg (0,54 mmol) 5-(4-Iod-1H-imidazol-1-yl)-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol, 161 mg (0,54 mmol) Methyl-2-chlor-5-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)benzoat, 31 mg (0,02 mmol) Tetrakis(triphenylphosphin)palladium und 1,66 mL einer 1M wässrigen Natriumhydrogencarbonat Lösung werden mit 20 mL Isopropylalkohol versetzt und 3h unter Rückfluß erhitzt. Die Reaktionsmischung wird bis zur Trockene eingengt und der Rückstand in Ethylacetat aufgenommen. Die organische Phase wird zweimal mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und bis zur Trockene eingengt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

**[0211]** Man erhält 160 mg 2-Chlor-5-{1-[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]-1H-imidazol-4-yl}benzoesäuremethylester als farblosen Feststoff.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{d}_3$ -Acetonitril):  $\delta = 8,28$  (d, 1H), 7,95 (dd, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 3,91 (s, 3H),

3,73 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS<sup>a)</sup>: logP = 4,26, Masse (m/z) = 503 [M+H]<sup>+</sup>.

5 **[0212]** 150 mg (0,29 mmol) 2-Chlor-5-{1-[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]-1H-imidazol-4-yl}benzoesäuremethylester werden in 6,3 mL Tetrahydrofura p.a. gelöst und mit Eis gekühlt. 8,54 mg Lithiumhydroxid gelöst in 0,7 mL Wasser werden zu der Reaktionslösung getropft. Nach 10 Minuten wird die Eiskühlung entfernt und das Reaktionsgemisch 18h bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wird mit 1M Salzsäure angesäuert und das Produkt mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wird mit gesättigter Natriumchlorid Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und unter vermindertem Druck eingeeengt.

10 **[0213]** Man erhält 127 mg ) 2-Chlor-5-{1-[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]-1H-imidazol-4-yl}benzoesäure als farblosen Feststoff.

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, d<sub>3</sub>-Acetonitril): δ = 8,31 (d, 1H), 7,96 (dd, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 3,73 (s, 3H) ppm. HPLC-MS<sup>a)</sup>: logP = 3,30, Masse (m/z) = 489 [M+H]<sup>+</sup>.

15 **[0214]** 127 mg (0,26 mmol) 2-Chlor-5-{1-[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]-1H-imidazol-4-yl}benzoesäure, 42 mg (0,39 mmol) Benzylamin und 67 mg (0,52 mmol) N,N-Diethyl-isopropylamin werden in einer Mischung aus 4,6 mL Dichlormethan und 0,4 mL N,N-Dimethylformamid gelöst. Es werden 53 mg (0,39 mmol) N-Hydroxybenzotriazol und 60 mg (0,31 mmol) N-Ethyl-N'-(3-Dimethylaminopropyl) Carbodiimid Hydrochlorid hinzugefügt. Das Reaktionsgemisch wird 16h bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktionslösung wird mit Ethylacetat verdünnt und anschließend nacheinander mit 1M Salzsäure, 1M Natronlauge und gesättigter Natriumchlorid Lösung gewaschen. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

20 **[0215]** Man erhält 77 mg N-Benzyl-2-chlor-5-{1-[1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-yl]-1H-imidazol-4-yl}benzamid als farblosen Feststoff.

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, d<sub>3</sub>-Acetonitril): δ = 7,94 (d, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,25-7,43 (m, 5H), 4,56 (d, 2H), 3,73 (s, 3H) ppm..

HPLC-MS<sup>a)</sup>: logP = 4,00, Masse (m/z) = 578 [M+H]<sup>+</sup>.

25 **[0216]** <sup>a)</sup> Anmerkung zur Bestimmung der logP-Werte und Massendetektion: Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Direktive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C18).Agilent 1100 LC-System; 50\*4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 microm; Eluent A: Acetonitril (0,1 % Ameisensäure); Eluent B: Wasser (0,09 % Ameisensäure); linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 95 % Acetonitril in 4,25 min, dann 95% Acetonitril für weitere 1,25 min; Ofentemperatur 55 °C; Fluß:2,0 mL/min. Die Massendetektion erfolgt über ein Agilent MSD-System.

30 **[0217]** Mit Hilfe der oben beschriebenen Darstellungsverfahren A bis C wurden die in den Tabellen 1 & 2 aufgeführten Verbindungen dargestellt.

35

40

45

50

55

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

Tabelle 1

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	R <sup>6c</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>(*)</sup>	Masse [m/z] <sup>(***)</sup>
la-1	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	O	3,99	552,0
la-2	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	O	4,08	527,0

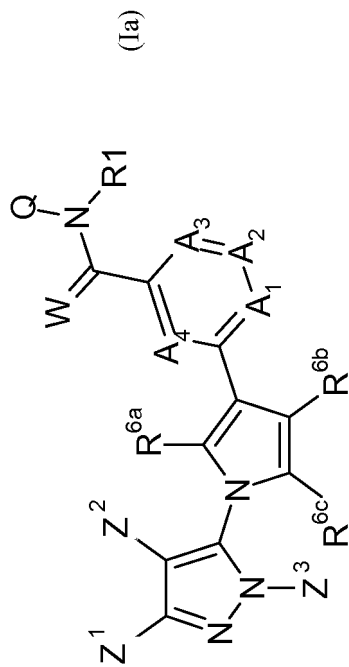
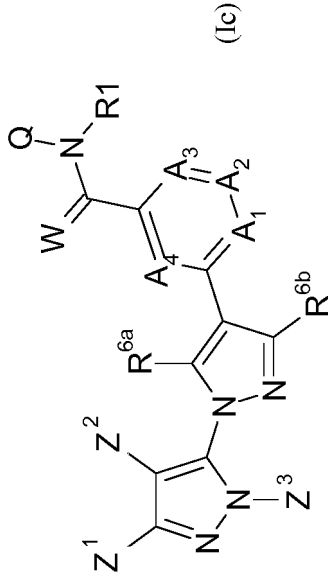




Tabelle 3

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
Ic-2	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-Cyano-cyclopropyl	3,72		553,1
Ic-3	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Benzyl	4,39		578,0
Ic-4	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	4,51		596,0
Ic-5	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	4,60		610,0
Ic-6	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Phenyl	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	4,54		590,1
Ic-7	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Phenyl	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-Cyano-cyclopropyl	4,43		615,1
Ic-8	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	4,54		635,1
Ic-9	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	4,02		556,0
Ic-10	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-Thienylmethyl	4,40		584,0
Ic-11	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-Carbamothioyl-cyclopropyl	3,59		587,0



5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
Ic-12	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	3,97		542,0
Ic-13	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	3,88		542,1
Ic-14	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-Chlorpyridin-2-yl	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	4,28		625,0
Ic-15	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-Chlorpyridin-2-yl	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-Cyano-cyclopropyl	4,15		650,0
Ic-16	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	4,14		542,0
Ic-17	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	Benzyl	4,31		544,0
Ic-18	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	3,66		494,1
Ic-19	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	1-Cano-cyclopropyl	3,61		519,1
Ic-20	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	2-Thienylmethyl	4,20		550,1
Ic-21	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-Cyano-cyclopropyl	4,04		567,1
Ic-22	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Pyrid-4-yl	2,38		565,0
Ic-23	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2,2,2-Trifluorethyl	4,17		570,0
Ic-24	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-F	C-H	O	Cyclopropyl	3,90		546,0
Ic-25	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	4-Chlorphenyl	4,93		598,0
Ic-26	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Methylsulfonyl	3,58		566,0

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
lc-27	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-F	C-H	O	1-Cyano-cyclopropyl	3,87		571,0
lc-28	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Thietan-3-yl	4,09		560,0
lc-29	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-Carbamoylcyclopropyl	3,07		571,0
lc-30	CF <sub>3</sub>	CN	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	2,97		435
lc-31	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroethyl)amino]ethyl	3,65		627
lc-32	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-(CF <sub>3</sub> )cyclopropyl	4,29		596
lc-33	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	O	cyclopropyl		1,19 <sup>b</sup>	512
lc-34	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Br	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,74		597
lc-35	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	H	3,1		454
lc-36	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,69		537
lc-37	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,79		512
lc-38	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-F	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		2,62 <sup>a</sup>	537
lc-39	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-F	C-H	O	cyclopropyl		2,62 <sup>a</sup>	512
lc-40	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,16 <sup>b</sup>	537
lc-41	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	cyclopropyl		2,61 <sup>a</sup>	512

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-42</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-F	O	1-cyanocyclopropyl		2,61 a	537
<b>lc-43</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,23 b	553
<b>lc-44</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	O	cyclopropyl		1,25 b	528
<b>lc-45</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-Cl	O	1-cyanocyclopropyl		1,22 b	553
<b>lc-46</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-Cl	O	cyclopropyl		1,28 b	528
<b>lc-47</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-F	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,24 b	555
<b>lc-48</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-F	C-Cl	O	1-cyanocyclopropyl		1,24 b	<b>569<sup>2</sup></b>
<b>lc-49</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-H	C-Cl	O	cyclopropyl		1,31 b	546
<b>lc-50</b>	CF <sub>3</sub>	(E/Z)-(hydroxyimino)methyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	2,47		453
<b>lc-51</b>	CF <sub>3</sub>	(E/Z)-(methoxyimino)ethyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,15		467
<b>lc-52</b>	CF <sub>3</sub>	formyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	2,67		438
<b>lc-53</b>	CF <sub>3</sub>	CN	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	2,92		460
<b>lc-54</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-Me	C-H	O	cyclopropyl		1,22 b	508
<b>lc-55</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-F	C-H	O	cyclopropyl		1,26 b	530
<b>lc-56</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-Me	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,21 b	533
<b>lc-57</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-Me	O	cyclopropyl		1,21 b	508

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
Ic-58	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-H	C-Me	O	1-cyanocyclopropyl		1,2 <sup>b</sup>	533
Ic-59	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-CF <sub>3</sub>	C-H	O	cyclopropyl		1,27 <sup>b</sup>	562
Ic-60	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-CF <sub>3</sub>	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,26 <sup>b</sup>	587
Ic-61	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-F	C-F	O	cyclopropyl		1,25 <sup>b</sup>	530
Ic-62	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-OMe	C-H	O	cyclopropyl		1,18 <sup>b</sup>	524
Ic-63	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-OMe	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,17 <sup>b</sup>	549
Ic-64	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-F	C-F	O	1-cyanocyclopropyl		1,24 <sup>b</sup>	553 <sup>2</sup>
Ic-65	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-NO <sub>2</sub>	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,48		564
Ic-66	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-NO <sub>2</sub>	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,53		539
Ic-67	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-OMe	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,77		549
Ic-68	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-OMe	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,86		524
Ic-69	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OH	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	2,15		439 <sup>3</sup>
Ic-70	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	N	C-H	O	cyclopropyl		1,08 <sup>b</sup>	495
Ic-71	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	N	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,06 <sup>b</sup>	520
Ic-72	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	N	C-H	C-F	O	cyclopropyl		1,24 <sup>b</sup>	513
Ic-73	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	N	C-H	C-F	O	1-cyanocyclopropyl		1,2 <sup>b</sup>	536 <sup>2</sup>
Ic-74	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-OCF <sub>3</sub>	C-H	O	cyclopropyl		1,29 <sup>b</sup>	578
Ic-75	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H	C-OCF <sub>3</sub>	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,27 <sup>b</sup>	603

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-76</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	N	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,19 <sup>b</sup>	520
<b>lc-77</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-fluoroethyl	3,67		534
<b>lc-78</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2,2-difluoroethyl	3,86		552
<b>lc-79</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-methylcyclopropyl	4,15		542
<b>lc-80</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2,2-difluoropropyl	4,05		566
<b>lc-81</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-fluorocyclopropyl	3,8		546
<b>lc-83</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	N	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		3,58 <sup>d</sup>	554
<b>lc-84</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Me	N	C-H	O	cyclopropyl		1,07 <sup>b</sup>	509
<b>lc-85</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Me	N	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		3,26 <sup>d</sup>	534
<b>lc-86</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-OMe	N	C-H	O	cyclopropyl		1,2 <sup>b</sup>	525
<b>lc-87</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-OMe	N	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,19 <sup>b</sup>	550
<b>lc-88</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	cyclopropyl		4,18 <sup>d</sup>	529
<b>lc-89</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		4,06 <sup>d</sup>	554
<b>lc-90</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-Me	C-H	O	cyclopropyl		1,22 <sup>b</sup>	542
<b>lc-91</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-Me	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,21 <sup>b</sup>	567
<b>lc-92</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-F	O	cyclopropyl		1,21 <sup>b</sup>	546

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-93</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-F	O	1-cyanocyclopropyl		1,2 <sup>b</sup>	571
<b>lc-94</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-Cl	C-H	O	cyclopropyl		1,28 <sup>b</sup>	562
<b>lc-95</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-Cl	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,23 <sup>b</sup>	587
<b>lc-96</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	4,1		567
<b>lc-97</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-(methyl-carbamoyl)cyclopropyl	3,58		599
<b>lc-98</b>	CF <sub>3</sub>	(E/Z)-(hydroxymino)methyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	2,42		478
<b>lc-99</b>	CF <sub>3</sub>	(E/Z)-(methoxyimino)ethyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,09		492
<b>lc-100</b>	CF <sub>3</sub>	cyclopropylcarbamoyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	2,31		493
<b>lc-101</b>	CF <sub>3</sub>	cyclopropylcarbamoyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	2,32		518
<b>lc-102</b>	CF <sub>3</sub>	formyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	2,61		463
<b>lc-103</b>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	2,89		442
<b>lc-104</b>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OH	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	2,13		465

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-105</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	N	C-H	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,21 <sup>b</sup>	520
<b>lc-106</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-F	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl		1,2 <sup>b</sup>	546
<b>lc-107</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-F	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,17 <sup>b</sup>	571
<b>lc-108</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	3-(methylsulfany)clobutyl	4,28		588
<b>lc-109</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	prop-2-yn-1-yl	3,69		526
<b>lc-110</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1,1,1-trifluoropropan-2-yl	4,23		584
<b>lc-111</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	buta-2,3-dien-1-yl	4,04		540
<b>lc-112</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	3-chloroprop-2-en-1-yl	4,13		562
<b>lc-113</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	isopropyl	4,01		530
<b>lc-114</b>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,12		458
<b>lc-115</b>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	2,89		467
<b>lc-116</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-oxidothiethan-3-yl	3,03		576
<b>lc-117</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1,1-dioxidothietan-3-yl	3,37		592

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-118</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-(E/Z)-(methoxyimino)methyl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,99		551
<b>lc-119</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-(methylsulfanyl)cyclobutyl	4,52		588
<b>lc-120</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-[(methylsulfonyl)methyl]cyclobutyl	4,56		602
<b>lc-121</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	formyl	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,09		513
<b>lc-122</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	3-(methylsulfonyl)cyclobutyl	3,24		620
<b>lc-123</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-[(methylsulfonyl)methyl]cyclobutyl	3,09		618
<b>lc-124</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	(1S,2R)-2-(methylsulfonyl)cyclobutyl	3,47		620
<b>lc-125</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-(methylsulfanyl)cyclobutyl	3,17		604
<b>lc-126</b>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,42		478
<b>lc-127</b>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,3		503

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
Ic-128	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	3-cyanothi- etan-3-yl	4,38		585
Ic-129	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Me	C-H	C-H	O	1-cyanocy- clopropyl	3,73		533
Ic-130	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Me	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,76		508
Ic-131	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Me	C-H	C-H	O	4-fluoroph- enyl	4,57		562
Ic-132	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	S	cyclopropyl	4,34		544
Ic-133	CF <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,01		460
Ic-134	CF <sub>3</sub>	S(O) Me	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocy- clopropyl	2,16		497
Ic-135	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	phenyl	4,1		514
Ic-136	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	phenyl		1,30 <sup>c</sup>	564
Ic-137	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	3-methylb- utan-2-yl		1,30 <sup>c</sup>	558
Ic-138	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-(dimeth- ylami- no)ethyl		0,89 <sup>c</sup>	559
Ic-139	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-methox- yethyl		1,19 <sup>c</sup>	546
Ic-140	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	pyridin-2-yl		1,25 <sup>c</sup>	565
Ic-141	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopentyl		1,26 <sup>c</sup>	556
Ic-142	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	isobutyl		1,25 <sup>c</sup>	544
Ic-143	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclobutyl		1,27 <sup>c</sup>	542
Ic-144	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1 H-tetra- zol-5-yl		1,16 <sup>c</sup>	556

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>Ic-145</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1,2-oxazol-3-yl		1,22 c	555
<b>Ic-146</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1H-imidazol-2-ylmethyl		0,89 c	568
<b>Ic-147</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyanomethyl		1,13 b	527
<b>Ic-148</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	5-methyl-1,2-oxazol-3-yl		1,27 c	569
<b>Ic-149</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	pyridin-3-yl		1,20 c	565
<b>Ic-150</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1H-pyrazol-3-yl		1,19 c	554
<b>Ic-151</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	3-chloropropyl		1,23 c	564
<b>Ic-152</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	methyl		1,17 c	502
<b>Ic-153</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropylmethyl		1,23 c	542
<b>Ic-154</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-amino-1-oxopropan-2-yl		1,10 c	559
<b>Ic-155</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	methoxy		1,16 c	518
<b>Ic-156</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-amino-2-oxoethyl		1,08 c	545
<b>Ic-157</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1H-pyrazol-3-ylmethyl		1,13 c	568
<b>Ic-158</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	5-methyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl		1,13 b	570

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-159</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-methyl-1H-pyrazol-3-yl		3,73 <sup>d</sup>	568
<b>lc-160</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	4-methyl-1,3-oxazol-2-yl		1,19 <sup>c</sup>	569
<b>lc-161</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyclopropylpropan-2-yl		1,27 <sup>c</sup>	570
<b>lc-162</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	5-hydroxy-1H-pyrazol-3-yl		1,15 <sup>c</sup>	570
<b>lc-163</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-methyl-1H-pyrazol-5-yl		1,14 <sup>b</sup>	568
<b>lc-164</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	(3R)-tetrahydrofuran-3-yl		1,18 <sup>c</sup>	558
<b>lc-165</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-methoxypropan-2-yl		1,21 <sup>c</sup>	560
<b>lc-166</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-methyl-1H-pyrazol-4-yl		1,13 <sup>b</sup>	568
<b>lc-167</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-(methylsulfonyl)ethyl		1,19 <sup>b</sup>	562
<b>lc-168</b>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-fluoroethyl	3,24		484
<b>lc-169</b>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2,2,2-trifluoroethyl	3,71		520

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-170</b>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2,2-difluoroethyl	3,43		502
<b>lc-171</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H		C-O-CF <sub>2</sub> -O-C	O	cyclopropyl		2,77 a	574
<b>lc-172</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-H		C-O-CF <sub>2</sub> -O-C	O	1-cyanocyclopropyl		2,73 a	599
<b>lc-173</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-sulfamoyl	C-H	O	cyclopropyl		2,4 a	591
<b>lc-174</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-F	C-F	C-H	C-H	O	cyclopropyl		2,56 a	530
<b>lc-175</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-F	C-F	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		2,55 a	555
<b>lc-176</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-ethoxycyclopropyl	4,08		572
<b>lc-177</b>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-fluorocyclopropyl	3,41		496
<b>lc-178</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	N	C-H	N	C-H	O	cyclopropyl		1,17 b	496
<b>lc-179</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	N	C-H	N	C-H	O	1-cyanocyclopropyl		1,15 b	521
<b>lc-180</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	(1R,2R)-2-ethoxycyclopropyl	3,99		572
<b>lc-181</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2-(CF <sub>3</sub> )cyclopropyl	4,26		596
<b>lc-182</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-SMe	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,81		540
<b>lc-183</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	(1S,2S,3S)-2-ethoxy-3-methylcyclopropyl	4,34		586
<b>lc-184</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	2,2-dichlorocyclopropyl	4,34		596

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-185</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-diethylsulfamoyl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,99		629
<b>lc-186</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	(1S,2S)-2-ethoxycyclopropyl	3,73		572
<b>lc-187</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-methoxycyclopropyl	3,83		558
<b>lc-188</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1,1'-bi(cyclopropyl)-1-yl	4,43		568
<b>lc-189</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-S(O)Me	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,19		556
<b>lc-190</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-S(O)2Me	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,35		572
<b>lc-191</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	amino	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,3		568
<b>lc-192</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	amino	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,35		543
<b>lc-193</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	but-3-yn-2-yl	3,97		540
<b>lc-194</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocyclopropyl	3,56		531
<b>lc-195</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-sulfamoyl	C-H	O	cyclopropyl		3,31 <sup>d</sup>	607
<b>lc-196</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-CF <sub>3</sub>	C-H	C-H	O	cyclopropyl	3,96		562
<b>lc-197</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	Et	H	H	C-H	C-cyclopropylsulfamoyl	C-H	C-H	O	ethyl	4,39		629
<b>lc-198</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	pent-3-yn-2-yl	4,27		554
<b>lc-199</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl		2,72 <sup>a</sup>	542

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

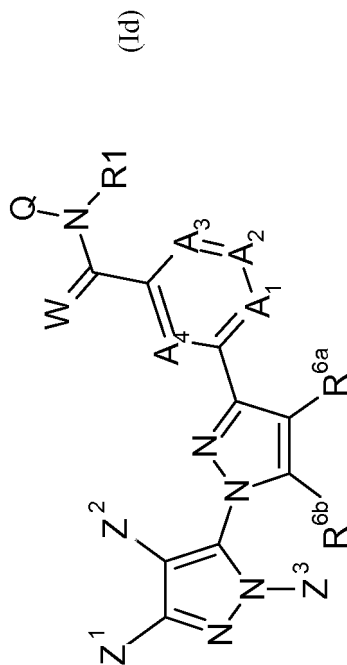
(fortgesetzt)

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Retentionszeit <sup>**</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
<b>lc-200</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-methylcy- clopropyl	4,12		542
<b>lc-201</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-F	C-F	O	cyclopropyl		4,09 <sup>d</sup>	548
<b>lc-202</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-F	C-F	C-F	O	1-cyanocy- clopropyl		4,03 <sup>b</sup>	573
<b>lc-203</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-CF <sub>3</sub>	C-H	C-H	O	1-cyanocy- clopropyl	3,88		587
<b>lc-204</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	nPr	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocy- clopropyl	4,56		595
<b>lc-205</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	propio- nyl	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocy- clopropyl	4,63		609
<b>lc-206</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	allyl	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocy- clopropyl	4,44		593
<b>lc-207</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyclopro- pylethyl	4,4		556
<b>lc-208</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	Et	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocy- clopropyl	4,33		581
<b>lc-209</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	4-fluoroph- enyl	4,53		582
<b>lc-210</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyclobu- tylcyclopro- pyl	4,77		582
<b>lc-211</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	Et	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl		1,35 <sup>b</sup>	556
<b>lc-212</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	cyclopropyl		1,09 <sup>b</sup>	494
<b>lc-213</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-cyanocy- clopropyl		1,09 <sup>b</sup>	519
<b>lc-214</b>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	pyrazin-2-yl		1,24 <sup>c</sup>	566

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

**Tabelle 4**

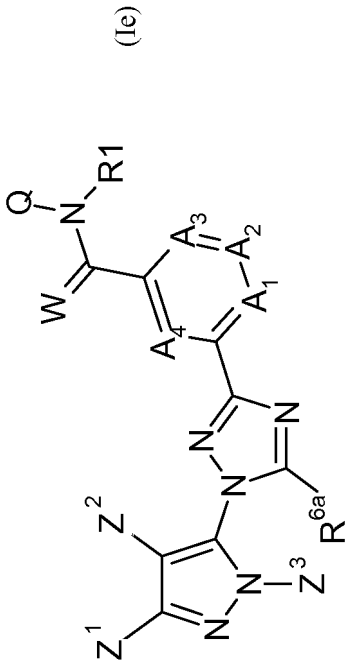
Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>	
Id-1	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	O	1-Cyano-cyclopropyl	3,87	553,1
Id-2	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	3,97	528,0



5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

**Table 5**

Bsp.-Nr.	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logP <sup>*</sup>	Masse [m/z] <sup>***</sup>
le-1	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	1-Cyano-cyclopropyl	3,62	554,0 <sup>a</sup>
le-2	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	C-H	C-Cl	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	3,72	529,0 <sup>a</sup>
le-3	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	Cyclopropyl	3,50	495,1
le-4	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	2-Thienylmethyl	4,05	551,1
le-5	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	6-Chloropyridin-3-yl	4,24	566,1
le-6	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	1-Carbamothioylcyclopropyl	3,29	554,1
le-7	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	C-H	C-H	C-H	C-H	O	1-Cyano-cyclopropyl	3,46	520,1



## EP 2 953 942 B1

**[0218]** Bei der angegebenen Masse handelt es sich um den Peak des Isotopenmusters des  $[M+H]^+$  Ions mit der höchsten Intensität; falls das  $[M-H]^-$  Ion detektiert wurde, ist die Massenangabe mit <sup>2</sup> gekennzeichnet.

<sup>2</sup> Bei der angegebenen Masse handelt es sich um den Peak des Isotopenmusters des  $[M-H]^-$  Ions mit der höchsten Intensität. Falls die Masse aus einer GCMS (Verfahren s.u.) Messung ist die Massenangabe mit <sup>3</sup> gekennzeichnet.

<sup>\*</sup>) Anmerkung zur Bestimmung der logP-Werte und Massendetektion: Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Direktive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C18). Agilent 1100 LC-System; 50\*4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 microm; Eluent A: Acetonitril (0,1 % Ameisensäure); Eluent B: Wasser (0,09 % Ameisensäure); linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 95 % Acetonitril in 4,25 min, dann 95% Acetonitril für weitere 1,25 min; Ofentemperatur 55 °C; Fluß: 2,0 mL/min. Die Massendetektion erfolgt über ein Agilent MSD-System.

<sup>\*\*</sup>) Anmerkung zur Bestimmung der Retentionszeiten. Die Messung der Retentionszeiten und die dazugehörige Massenspektroskopie wurde nach folgenden Verfahren durchgeführt:

<sup>a</sup>) Instrument: Micromass Quattro Premier mit Waters UPLC Acquity; Säule: Thermo Hypersil GOLD 1.9  $\mu$  50 x 1 mm; Eluent A: 1 l Wasser + 0.5 ml 50%ige Ameisensäure, Eluent B: 1 l Acetonitril + 0.5 ml 50%ige Ameisensäure; Gradient: 0.0 min 97% A  $\rightarrow$  0.5 min 97% A  $\rightarrow$  3.2 min 5% A  $\rightarrow$  4.0 min 5% A Ofen: 50°C; Fluss: 0.3 ml/min; UV-Detektion: 210 nm.

<sup>b</sup>) Instrument: Waters ACQUITY SQD UPLC System; Säule: Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8  $\mu$  50 x 1 mm; Eluent A: 1 l Wasser + 0.25 ml 99%ige Ameisensäure, Eluent B: 1 l Acetonitril + 0.25 ml 99%ige Ameisensäure; Gradient: 0.0 min 90% A  $\rightarrow$  1.2 min 5% A  $\rightarrow$  2.0 min 5% A Ofen: 50°C; Fluss: 0.40 ml/min; UV-Detektion: 208 - 400 nm.

<sup>c</sup>) Instrument MS: Waters SQD; Instrument HPLC: Waters UPLC; Säule: Zorbax SB-Aq (Agilent), 50 mm x 2.1 mm, 1.8  $\mu$ m; Eluent A: Wasser + 0.025% Ameisensäure, Eluent B: Acetonitril (ULC) + 0.025% Ameisensäure; Gradient: 0.0 min 98%A - 0.9 min 25%A - 1.0 min 5%A - 1.4 min 5%A - 1.41 min 98%A - 1.5 min 98%A; Ofen: 40°C; Fluss: 0.600 ml/min; UV-Detektion: DAD; 210 nm.

<sup>d</sup>) Instrument: Waters ACQUITY SQD UPLC System; Säule: Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8  $\mu$  50 x 1 mm; Eluent A: 1 l Wasser + 0.25 ml 99%ige Ameisensäure, Eluent B: 1 l Acetonitril + 0.25 ml 99%ige Ameisensäure; Gradient: 0.0 min 95% A  $\rightarrow$  6.0 min 5% A  $\rightarrow$  7.5 min 5% A Ofen: 50°C; Fluss: 0.35 ml/min; UV-Detektion: 210 - 400 nm.

### NMR-Daten ausgewählter Beispiele

#### NMR-Peak-Listenverfahren

**[0219]** Die <sup>1</sup>H-NMR-Daten ausgewählter Beispiele werden in Form von <sup>1</sup>H-NMR-Peaklisten notiert. Zu jedem Signalpeak wird erst der  $\delta$ -Wert in ppm und dann die Signalintensität in runden Klammern aufgeführt. Die  $\delta$ -Wert - Signalintensitäts- Zahlenpaare von verschiedenen Signalpeaks werden durch Semikolons voneinander getrennt aufgelistet.

**[0220]** Die Peakliste eines Beispiels hat daher die Form:

$\delta_1$  (Intensität<sub>1</sub>);  $\delta_2$  (Intensität<sub>2</sub>); .....;  $\delta_i$  (Intensität<sub>i</sub>); .....;  $\delta_n$  (Intensität<sub>n</sub>)

**[0221]** Die Intensität scharfer Signale korreliert mit der Höhe der Signale in einem gedruckten Beispiel eines NMR-Spektrums in cm und zeigt die wirklichen Verhältnisse der Signalintensitäten. Bei breiten Signalen können mehrere Peaks oder die Mitte des Signals und ihre relative Intensität im Vergleich zum intensivsten Signal im Spektrum gezeigt werden.

**[0222]** Zur Kalibrierung der chemischen Verschiebung von <sup>1</sup>H-NMR-Spektren benutzen wir Tetramethylsilan und/oder die chemische Verschiebung des Lösungsmittels, besonders im Falle von Spektren, die in DMSO gemessen werden. Daher kann in NMR-Peaklisten der Tetramethylsilan-Peak vorkommen, muss es aber nicht.

**[0223]** Die Listen der <sup>1</sup>H-NMR-Peaks sind ähnlich den klassischen <sup>1</sup>H-NMR-Ausdrücken und enthalten somit gewöhnlich alle Peaks, die bei einer klassischen NMR-Interpretation aufgeführt werden.

**[0224]** Darüber hinaus können sie wie klassische <sup>1</sup>H-NMR-Ausdrücke Lösungsmittelsignale, Signale von Stereoisomeren der Zielverbindungen, die ebenfalls Gegenstand der Erfindung sind, und/oder Peaks von Verunreinigungen zeigen.

**[0225]** Bei der Angabe von Verbindungssignalen im Delta-Bereich von Lösungsmitteln und/oder Wasser sind in un-

## EP 2 953 942 B1

seren Listen von <sup>1</sup>H-NMR-Peaks die gewöhnlichen Lösungsmittelpeaks, zum Beispiel Peaks von DMSO in DMSO-D<sub>6</sub> und der Peak von Wasser, gezeigt, die gewöhnlich im Durchschnitt eine hohe Intensität aufweisen.

**[0226]** Die Peaks von Stereoisomeren der Targetverbindungen und/oder Peaks von Verunreinigungen haben gewöhnlich im Durchschnitt eine geringere Intensität als die Peaks der Zielverbindungen (zum Beispiel mit einer Reinheit von >90%).

**[0227]** Solche Stereoisomere und/oder Verunreinigungen können typisch für das jeweilige Herstellungsverfahren sein. Ihre Peaks können somit dabei helfen, die Reproduktion unseres Herstellungsverfahrens anhand von "Nebenprodukt-Fingerabdrücken" zu erkennen.

**[0228]** Einem Experten, der die Peaks der Zielverbindungen mit bekannten Verfahren (MestreC, ACD-Simulation, aber auch mit empirisch ausgewerteten Erwartungswerten) berechnet, kann je nach Bedarf die Peaks der Zielverbindungen isolieren, wobei gegebenenfalls zusätzliche Intensitätsfilter eingesetzt werden. Diese Isolierung wäre ähnlich dem betreffenden Peak-Picking bei der klassischen <sup>1</sup>H-NMR-Interpretation.

**[0229]** Weitere Details zu <sup>1</sup>H-NMR-Peaklisten können der Research Disclosure Database Number 564025 entnommen werden.

Beispiel Ia-1: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 7,676(2,1); 7,671(3,1); 7,659(1,8); 7,653(1,0); 7,638(2,0); 7,633(1,6); 7,618(1,0); 7,462(3,1); 7,442(2,2); 7,349(1,5); 7,344(2,3); 7,340(1,3); 6,998(1,3); 6,992(1,8); 6,985(1,3); 6,813(1,7); 6,809(1,8); 6,806(1,7); 6,801(1,4); 3,690(11,5); 2,469(0,4); 2,464(0,6); 2,459(0,4); 2,163(185,6); 2,120(0,5); 2,114(0,7); 2,108(0,9); 2,101(0,6); 1,972(1,3); 1,965(8,3); 1,958(13,7); 1,953(59,4); 1,946(104,0); 1,940(134,9); 1,934(91,2); 1,928(46,0); 1,781(0,3); 1,775(0,6); 1,769(0,8); 1,763(0,5); 1,589(1,2); 1,575(3,1); 1,568(2,9); 1,554(1,7); 1,437(16,0); 1,357(1,6); 1,343(2,9); 1,336(3,2); 1,322(1,5); 1,317(0,4); 1,135(0,8); 0,146(0,4); 0,008(4,0); 0,000(103,9); -0,009(3,2); -0,149(0,4)

Beispiel Ia-2: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 7,632(3,0); 7,627(4,1); 7,609(2,3); 7,603(1,4); 7,588(2,5); 7,583(1,9); 7,429(3,8); 7,408(3,0); 7,335(2,0); 7,330(3,3); 7,325(1,9); 6,991(1,8); 6,985(2,7); 6,978(1,8); 6,922(0,9); 6,802(2,3); 6,798(2,4); 6,795(2,2); 6,791(1,9); 4,068(0,5); 4,050(0,5); 3,803(0,5); 3,687(16,0); 2,863(0,7); 2,854(1,0); 2,845(1,5); 2,836(1,5); 2,827(1,0); 2,818(0,7); 2,641(0,8); 2,462(0,4); 2,160(73,5); 2,113(0,4); 2,107(0,5); 2,101(0,3); 1,972(2,6); 1,964(5,0); 1,958(7,4); 1,952(31,4); 1,946(54,8); 1,940(70,8); 1,934(47,6); 1,928(24,2); 1,768(0,4); 1,437(2,8); 1,320(0,5); 1,299(0,6); 1,221(0,6); 1,203(1,4); 1,186(0,6); 1,134(10,8); 0,788(0,9); 0,775(2,6); 0,770(3,2); 0,757(3,6); 0,752(2,4); 0,740(1,2); 0,606(1,1); 0,595(3,0); 0,588(3,0); 0,585(2,7); 0,579(2,6); 0,567(0,9); 0,008(3,1); 0,000(69,8); -0,009(2,3); -0,150(0,3)

Beispiel Ib-1: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 7,942(3,4); 7,936(3,9); 7,892(2,3); 7,886(1,9); 7,871(2,5); 7,865(2,1); 7,818(3,6); 7,815(3,6); 7,708(4,8); 7,705(4,3); 7,509(3,9); 7,488(3,5); 7,424(1,4); 7,420(1,9); 7,403(4,5); 7,387(3,5); 7,382(1,4); 7,369(4,8); 7,365(2,3); 7,350(2,0); 7,304(1,3); 7,286(1,6); 7,268(0,6); 4,566(5,2); 4,551(5,0); 4,085(0,4); 4,068(1,1); 4,050(1,1); 4,032(0,4); 3,730(16,0); 2,467(0,4); 2,463(0,5); 2,458(0,3); 2,164(93,1); 2,133(0,4); 2,120(0,4); 2,113(0,5); 2,107(0,6); 2,101(0,5); 1,972(5,7);

1,964(7,5); 1,958(11,7); 1,952(44,6); 1,946(77,0); 1,940(99,3); 1,934(68,5); 1,928(35,2); 1,775(0,5); 1,768(0,6); 1,762(0,4); 1,437(0,4); 1,271(0,4); 1,221(1,3); 1,204(2,6); 1,186(1,3); 0,000(5,1)

Beispiel Ib-2: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 7,921(8,4); 7,903(2,6); 7,897(1,6); 7,819(3,5); 7,709(4,4); 7,706(3,9); 7,587(1,1); 7,571(0,4); 7,518(2,4); 7,515(1,6); 7,499(1,5); 7,496(2,2); 5,447(0,8); 3,731(16,0); 2,139(49,6); 2,119(0,6); 2,113(0,8); 2,107(1,0); 2,101(0,7); 2,095(0,3); 1,964(10,0); 1,958(15,9); 1,952(65,9); 1,946(114,1); 1,940(147,1); 1,934(100,3); 1,927(51,2); 1,915(1,0); 1,780(0,5); 1,774(0,7); 1,768(0,9); 1,762(0,6); 1,756(0,4); 1,589(1,7); 1,575(4,4); 1,568(4,1); 1,555(2,2); 1,514(0,4); 1,367(2,4); 1,354(4,2); 1,347(4,5); 1,341(1,8); 1,332(1,8); 1,294(0,5); 1,285(2,1); 1,271(1,1); 1,262(0,5); 0,008(0,8); 0,000(21,6); -0,009(0,7)

Beispiel Ib-3: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 7,875(1,0); 7,871(3,0); 7,851(1,1); 7,846(0,7); 7,813(1,2); 7,810(1,2); 7,692(1,7); 7,689(1,6); 7,480(1,1); 7,478(0,9); 7,460(0,8); 7,458(0,9); 5,447(16,0); 4,085(0,5); 4,067(1,4); 4,050(1,4); 4,032(0,5); 3,729(5,6); 2,856(0,4); 2,848(0,6); 2,838(0,6); 2,830(0,4); 2,142(4,0); 1,971(6,7); 1,964(1,0); 1,958(1,5); 1,952(6,2); 1,946(11,0); 1,940(14,3); 1,934(9,8); 1,927(5,0); 1,437(0,6); 1,372(1,0); 1,277(1,2); 1,221(1,8); 1,203(3,6); 1,186(1,8); 1,135(2,6); 1,099(0,3); 0,778(0,9); 0,772(1,2); 0,760(1,3); 0,754(0,9); 0,742(0,4); 0,610(0,4); 0,600(1,0); 0,598(1,0); 0,592(1,1); 0,588(0,9); 0,583(0,9); 0,008(1,0); 0,000(23,8); -0,009(0,9)

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

Beispiel Ic-1: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 8,261(5,7); 8,235(5,4); 7,699(3,4); 7,693(4,3); 7,664(2,4); 7,658(1,7); 7,643(2,8); 7,637(2,3); 7,491(4,2);  
 7,470(3,2); 6,953(0,8); 5,448(1,2); 4,086(0,5); 4,068(1,4); 4,050(1,4); 4,032(0,5); 3,749(16,0); 2,873(0,7);  
 2,863(1,0); 2,854(1,5); 2,845(1,5); 2,836(1,0); 2,827(0,7); 2,170(41,6); 2,120(0,4); 2,114(0,4); 2,108(0,5);  
 2,102(0,3); 1,972(6,7); 1,965(3,6); 1,959(5,6); 1,953(25,2); 1,947(44,3); 1,940(57,9); 1,934(39,8); 1,928(20,4);  
 1,769(0,3); 1,437(5,6); 1,372(3,6); 1,340(0,5); 1,285(0,8); 1,277(3,9); 1,222(1,7); 1,204(3,3); 1,186(1,6);  
 0,798(0,8); 0,785(2,5); 0,780(3,2); 0,767(3,4); 0,762(2,4); 0,750(1,1); 0,614(1,1); 0,603(2,7); 0,596(2,8);  
 0,592(2,4); 0,587(2,5); 0,574(0,8); 0,146(0,4); 0,008(3,5); 0,000(89,6); -0,009(3,3); -0,150(0,4)

Beispiel Ic-2: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 8,270(2,7); 8,246(2,5); 7,749(1,6); 7,743(2,1); 7,714(1,1); 7,708(0,8); 7,693(1,3); 7,687(1,1); 7,570(0,6);  
 7,524(2,0); 7,504(1,6); 6,878(0,3); 6,872(0,7); 3,751(7,9); 2,612(0,7); 2,138(33,6); 2,107(0,4); 1,972(1,6);  
 1,964(3,4); 1,958(5,2); 1,952(23,5); 1,946(41,4); 1,940(54,4); 1,934(37,3); 1,927(19,0); 1,768(0,3); 1,602(0,9);  
 1,588(2,0); 1,581(2,0); 1,568(1,1); 1,550(0,4); 1,543(0,4); 1,437(16,0); 1,372(1,2); 1,363(1,2); 1,349(2,0);  
 1,342(2,2); 1,328(0,9); 1,312(0,4); 1,305(0,5); 1,285(0,4); 1,277(1,4); 1,222(0,4); 1,204(0,8); 1,186(0,4);  
 1,135(9,5); 0,146(0,3); 0,015(0,4);

0,008(2,8); 0,000(79,4); -0,009(2,6); -0,149(0,3)

Beispiel Ic-3: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 8,271(5,6); 8,248(5,2); 7,763(3,4); 7,758(3,9); 7,687(1,9); 7,682(1,7); 7,666(2,4); 7,661(2,2); 7,521(3,9);  
 7,500(3,1); 7,423(1,9); 7,406(4,3); 7,388(3,0); 7,383(1,1); 7,370(4,6); 7,351(2,3); 7,305(1,3); 7,287(1,6);  
 7,269(0,6); 4,570(5,3); 4,555(5,1); 4,050(0,3); 3,750(16,0); 2,462(0,4); 2,155(71,7); 2,120(0,4); 2,113(0,4);  
 2,107(0,6); 2,101(0,4); 1,972(1,9); 1,964(6,1); 1,958(9,3); 1,952(39,2); 1,946(68,5); 1,940(89,0); 1,934(61,3);  
 1,927(31,5); 1,774(0,4); 1,768(0,5); 1,762(0,4); 1,437(1,5); 1,270(0,4); 1,221(0,4); 1,204(0,8); 1,186(0,4);  
 0,000(4,2)

Beispiel Ic-4: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 8,171(3,2); 7,551(0,9); 7,531(7,5); 7,528(5,7); 7,524(4,9); 7,519(1,3); 7,504(0,6); 7,498(0,5); 6,937(0,8);  
 4,068(0,9); 4,050(0,9); 3,881(0,4); 3,790(15,9); 3,714(0,7); 2,864(0,7); 2,854(1,0); 2,846(1,5); 2,836(1,6);  
 2,828(1,0); 2,818(0,7); 2,467(0,4); 2,462(0,6); 2,458(0,4); 2,230(1,3); 2,138(154,8); 2,119(1,8); 2,113(2,3);  
 2,107(3,0); 2,101(2,0); 2,095(1,0); 1,972(6,5); 1,964(29,3); 1,958(46,1); 1,952(191,8); 1,946(333,8); 1,940(431,2);  
 1,933(293,7); 1,927(149,0); 1,915(1,9); 1,780(1,0); 1,774(1,8); 1,768(2,5); 1,762(1,6); 1,756(0,8); 1,437(16,0);  
 1,270(0,9); 1,222(1,1); 1,204(2,3); 1,186(1,0); 1,135(1,3); 0,793(0,8); 0,780(2,4); 0,775(3,2); 0,762(3,4);  
 0,757(2,4); 0,745(1,2); 0,599(1,1); 0,587(2,6); 0,581(2,7); 0,577(2,4); 0,572(2,5); 0,559(0,8); 0,146(1,1);  
 0,008(10,1); 0,000(267,4); -0,009(8,5); -0,150(1,1)

Beispiel Ic-5: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 7,562(1,8); 7,560(1,5); 7,542(2,1); 7,540(2,3); 7,444(0,5); 7,439(0,6); 7,428(6,0); 7,420(1,6); 7,416(0,9);  
 7,414(0,8); 7,412(1,0); 7,408(1,9); 7,402(1,5); 7,399(1,4); 7,397(1,0); 7,394(1,3); 7,389(0,4); 7,375(0,6);  
 7,361(0,8); 7,356(0,7); 7,343(0,6); 7,339(0,7); 6,961(0,7); 4,086(0,4); 4,068(1,3); 4,050(1,3); 4,032(0,4);  
 3,921(0,5); 3,815(0,4); 3,756(13,3); 3,402(0,5); 2,858(0,6); 2,849(0,8); 2,840(1,3); 2,831(1,3); 2,825(0,9);  
 2,822(1,0); 2,816(0,8); 2,813(0,7); 2,807(0,5); 2,798(0,3); 2,633(1,0); 2,472(0,5); 2,467(0,7); 2,462(0,9);  
 2,458(0,6); 2,453(0,3); 2,153(129,0); 2,121(18,1); 2,114(1,5); 2,107(1,4); 2,101(0,9); 2,095(0,5); 1,972(7,3);  
 1,964(15,2); 1,958(24,6); 1,952(98,5); 1,946(171,1); 1,940(219,8); 1,934(149,3); 1,928(75,1); 1,915(0,9);  
 1,781(0,5); 1,775(0,9); 1,768(1,3); 1,762(0,8); 1,756(0,4); 1,437(1,2); 1,285(0,4); 1,270(1,0); 1,222(1,6);  
 1,204(3,3); 1,186(1,6); 1,135(16,0); 0,789(0,7); 0,777(2,2); 0,772(2,7); 0,759(3,5); 0,754(2,5); 0,744(1,7);  
 0,742(1,6); 0,727(0,5); 0,602(0,9); 0,592(2,2); 0,590(2,2); 0,585(2,7); 0,581(2,2); 0,575(3,0); 0,567(1,3);  
 0,563(1,6); 0,558(1,0); 0,146(0,6); 0,008(5,9); 0,000(143,6); -0,009(4,7); -0,150(0,6)

Beispiel Ic-6: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

δ = 8,131(8,4); 7,586(2,0); 7,580(2,4); 7,549(1,2); 7,544(0,9); 7,528(1,6); 7,523(1,3); 7,481(0,9); 7,475(0,4);  
 7,468(0,9); 7,464(1,7); 7,457(2,1); 7,453(1,0); 7,440(3,5); 7,438(3,1); 7,426(0,5);

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5	7,420(2,4); 7,341(0,3); 7,334(2,3); 7,331(2,4); 7,326(1,2); 7,319(0,6); 7,313(1,9); 7,309(1,3); 6,954(0,6); 2,853(0,4); 2,843(0,6); 2,834(0,9); 2,825(0,9); 2,816(0,6); 2,807(0,5); 2,524(0,4); 2,471(0,6); 2,467(0,7); 2,462(0,6); 2,200(267,1); 2,115(0,4); 2,108(0,4); 2,102(0,3); 1,972(1,9); 1,965(5,2); 1,959(8,2); 1,953(33,9); 1,947(58,8); 1,941(76,0); 1,935(52,0); 1,929(26,6); 1,776(0,3); 1,770(0,4); 1,437(16,0); 1,222(0,4); 1,204(0,7); 1,186(0,3); 0,785(0,5); 0,772(1,5); 0,767(1,9); 0,754(2,0); 0,749(1,4); 0,737(0,7); 0,594(0,7); 0,583(1,7); 0,577(1,8); 0,573(1,6); 0,567(1,6); 0,555(0,5); 0,008(1,8); 0,000(40,5); -0,009(1,4)
10	Beispiel Ic-7: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d <sub>3</sub> ): $\delta = 8,140(16,0); 7,637(4,5); 7,632(5,2); 7,599(4,2); 7,594(3,6); 7,578(3,8); 7,573(3,1); 7,501(0,6); 7,493(0,5); 7,484(2,0); 7,474(5,7); 7,470(2,7); 7,466(3,8); 7,462(3,0); 7,458(4,9); 7,453(5,1); 7,445(1,9); 7,443(2,4); 7,439(5,5); 7,427(0,9); 7,422(1,6); 7,417(1,2); 7,343(0,7); 7,336(5,2); 7,332(5,3); 7,328(2,6); 7,320(1,4); 7,315(4,1); 7,311(2,9); 4,068(0,7); 4,050(0,6); 2,472(1,3); 2,467(2,5); 2,462(3,4); 2,458(2,4); 2,453(1,2); 2,243(0,4); 2,151(557,2); 2,126(1,5); 2,120(3,4); 2,113(4,7); 2,107(5,6); 2,101(3,9); 2,095(2,0); 2,083(0,4); 1,971(8,0); 1,964(62,9); 1,958(99,0); 1,952(403,2); 1,946(705,3); 1,940(916,1); 1,934(628,4); 1,927(319,6); 1,915(4,5); 1,792(0,4); 1,781(2,2); 1,774(3,9); 1,768(5,2); 1,762(3,6); 1,756(1,8); 1,588(2,1); 1,574(5,3); 1,567(5,3); 1,553(2,9); 1,512(0,3); 1,437(11,9); 1,382(0,3); 1,372(0,3); 1,342(3,0); 1,328(5,3); 1,321(5,7); 1,307(2,2); 1,292(0,5); 1,277(0,9); 1,271(1,1); 1,221(0,8); 1,204(1,6); 1,193(0,3); 1,186(0,8); 1,135(0,7); 0,146(1,8); 0,008(18,4); 0,000(481,6); -0,009(16,9); -0,150(1,9)$
15	Beispiel Ic-8: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d <sub>3</sub> ): $\delta = 8,261(0,9); 8,254(6,6); 8,249(2,2); 8,236(2,3); 8,231(6,8); 8,224(0,7); 8,181(7,5); 8,174(6,7); 7,626(4,0); 7,621(4,9); 7,588(2,6); 7,583(1,9); 7,567(3,2); 7,562(2,6); 7,502(0,5); 7,494(0,9); 7,487(7,0); 7,482(2,5); 7,469(2,3); 7,464(7,1); 7,460(5,7); 7,439(3,6); 6,925(1,2); 4,068(0,7); 4,050(0,7); 2,865(0,3); 2,856(0,9); 2,846(1,3); 2,838(1,8); 2,828(1,9); 2,819(1,2); 2,810(0,9); 2,473(0,9); 2,468(1,6); 2,464(2,2); 2,459(1,6); 2,454(0,8); 2,338(0,6); 2,165(463,3); 2,133(1,1); 2,120(1,3); 2,114(2,0); 2,108(2,5); 2,101(1,7); 2,095(0,9); 1,972(6,9); 1,964(31,0); 1,958(47,6); 1,952(185,3); 1,946(318,3); 1,940(409,5); 1,934(278,7); 1,928(141,8); 1,781(1,0); 1,775(1,8); 1,769(2,3); 1,762(1,6); 1,756(0,7); 1,437(16,0); 1,269(0,7); 1,221(0,9); 1,204(1,9); 1,189(0,6); 1,186(0,9); 1,135(0,5); 0,788(1,0); 0,775(2,9); 0,770(3,9); 0,757(4,0); 0,752(2,9); 0,740(1,3); 0,597(1,4); 0,586(3,5); 0,580(3,5); 0,576(3,1); 0,570(3,1); 0,558(0,9); 0,146(0,8); 0,008(8,3); 0,000(190,9); -0,009(6,5); -0,150(0,9)$
20	Beispiel Ic-9: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d <sub>3</sub> ): $\delta = 7,531(2,2); 7,525(0,9); 7,513(1,2); 7,508(3,1); 7,394(9,0); 7,389(2,8); 7,377(2,3); 7,371(1,1); 6,917(0,8); 5,447(0,7); 4,086(0,4); 4,068(1,4); 4,050(1,4); 4,032(0,5); 3,692(16,0); 2,860(0,7); 2,852(1,0); 2,842(1,5); 2,833(1,5); 2,824(1,0); 2,815(0,7); 2,467(0,6); 2,462(0,8); 2,458(0,6);$
25	$2,255(21,6); 2,143(284,1); 2,113(23,4); 2,107(3,9); 2,101(2,1); 2,095(1,1); 1,972(9,9); 1,964(35,5); 1,958(54,3); 1,952(218,8); 1,946(374,8); 1,940(483,1); 1,934(328,2); 1,927(166,5); 1,915(2,0); 1,780(1,1); 1,774(2,1); 1,768(2,8); 1,762(1,8); 1,756(0,9); 1,437(1,8); 1,317(0,4); 1,301(0,4); 1,286(0,4); 1,271(0,9); 1,222(1,6); 1,204(3,3); 1,186(1,5); 1,135(1,3); 0,789(0,8); 0,777(2,4); 0,772(3,1); 0,759(3,2); 0,754(2,3); 0,742(1,1); 0,610(1,1); 0,600(2,7); 0,593(2,8); 0,589(2,4); 0,584(2,4); 0,571(0,7); 0,146(1,0); 0,008(10,6); 0,000(242,0); -0,009(7,6); -0,149(1,1)$
30	Beispiel Ic-10: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d <sub>3</sub> ): $\delta = 8,259(3,5); 8,238(3,2); 7,732(2,4); 7,727(2,4); 7,685(1,4); 7,680(1,0); 7,665(1,7); 7,659(1,3); 7,513(2,4); 7,492(1,8); 7,393(0,5); 7,324(1,4); 7,321(1,4); 7,311(1,5); 7,308(1,4); 7,072(1,3); 7,066(1,4); 6,992(1,4); 6,983(1,3); 6,979(1,3); 6,970(0,9); 4,729(3,3); 4,714(3,2); 4,067(0,5); 4,050(0,5); 3,747(10,0); 2,147(15,6); 2,144(17,9); 1,971(2,8); 1,964(2,8); 1,958(5,5); 1,952(16,6); 1,946(26,8); 1,940(32,1); 1,934(21,4); 1,927(10,4); 1,437(16,0); 1,221(0,6); 1,204(1,3); 1,186(0,6); 0,000(12,6); -0,008(0,4)$
35	Beispiel Ic-11: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d <sub>3</sub> ): $\delta = 8,285(3,7); 8,254(3,5); 8,092(0,3); 7,813(2,3); 7,807(2,5); 7,709(1,2); 7,703(1,1); 7,688(1,5); 7,682(1,4); 7,522(3,0); 7,501(2,1); 5,447(16,0); 4,085(0,5); 4,068(1,6); 4,050(1,6); 4,032(0,6); 3,755(9,9); 2,152(17,8); 1,981(1,3); 1,972(9,8); 1,961(4,0); 1,959(3,9); 1,952(13,4); 1,946(22,0); 1,940(28,1); 1,934(19,2); 1,928(9,8); 1,437(2,3); 1,393(1,2); 1,383(3,0); 1,374(2,9); 1,363(1,0); 1,221(1,9); 1,204(3,7); 1,186(1,8); 0,008(0,6); 0,000(11,7); -0,008(0,4)$
40	Beispiel Ic-12: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d <sub>3</sub> ):
45	
50	
55	

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 7,997(3,9); 7,540(4,7); 7,535(3,2); 7,524(3,2); 7,519(2,0); 7,504(4,1); 7,498(0,7); 7,488(0,4); 7,481(1,2); 6,918(0,7); 5,447(0,8); 4,068(0,5); 4,050(0,5); 3,753(12,5); 2,865(0,5); 2,856(0,8); 2,847(1,2); 2,837(1,2); 2,828(0,8); 2,819(0,5); 2,625(0,8); 2,432(16,0); 2,349(1,8); 2,152(76,1); 1,972(2,6); 1,964(3,1); 1,958(5,1); 1,953(18,8); 1,946(32,0); 1,940(40,4); 1,934(27,5); 1,928(13,8); 1,437(0,5); 1,277(10,6); 1,222(0,6); 1,204(1,2); 1,186(0,6); 1,135(6,6); 0,792(0,7); 0,779(1,9); 0,774(2,5); 0,762(2,6); 0,756(1,9); 0,744(0,8); 0,607(0,9); 0,596(2,3); 0,590(2,3); 0,586(2,1); 0,580(2,0); 0,568(0,6); 0,008(0,9); 0,000(16,2); -0,009(0,5)$

10

Beispiel Ic-13:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,034(5,1); 7,558(2,8); 7,554(4,1); 7,553(4,3); 7,530(4,2); 7,525(3,7); 7,518(4,7); 7,516(4,3); 7,498(1,0); 7,496(1,0); 6,936(0,9); 5,448(0,8); 4,068(0,6); 4,050(0,6); 3,692(16,0); 2,869(0,8); 2,860(1,0); 2,851(1,5); 2,842(1,6); 2,833(1,0); 2,824(0,8); 2,465(0,4); 2,350(1,7); 2,285(19,5); 2,257(0,3); 2,241(0,5); 2,160(348,0); 2,120(1,2); 2,114(1,1); 2,108(1,3); 2,101(0,9); 2,096(0,5); 1,972(4,3); 1,965(13,8); 1,959(22,0); 1,953(85,5); 1,947(147,8); 1,940(189,1); 1,934(128,4); 1,928(64,8); 1,781(0,4); 1,775(0,8); 1,769(1,1); 1,763(0,8); 1,757(0,4); 1,575(1,1); 1,558(1,1);$

15

$1,437(7,5); 1,315(0,6); 1,276(10,1); 1,222(0,8); 1,204(1,6); 1,186(0,8); 0,795(0,9); 0,782(2,4); 0,777(3,1); 0,764(3,3); 0,759(2,4); 0,747(1,1); 0,616(1,1); 0,605(2,8); 0,599(2,9); 0,595(2,6); 0,590(2,5); 0,577(0,8); 0,484(0,4); 0,146(0,4); 0,008(4,4); 0,000(79,8); -0,009(2,6); -0,150(0,3)$

20

Beispiel Ic-14:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,420(3,9); 8,416(4,1); 8,408(4,0); 8,404(3,9); 8,253(8,7); 8,079(0,5); 8,068(4,0); 8,065(4,0); 8,048(4,4); 8,044(4,1); 7,992(0,6); 7,981(10,8); 7,620(0,4); 7,588(6,7); 7,583(9,0); 7,573(4,6); 7,565(4,3); 7,553(7,1); 7,548(2,7); 7,533(5,0); 7,527(4,0); 7,473(0,6); 7,445(7,8); 7,424(5,3); 7,299(0,5); 7,272(0,6); 7,234(1,0); 7,229(0,5); 7,216(0,6); 7,211(1,0); 7,076(0,5); 7,053(0,5); 6,885(1,7); 6,837(4,2); 6,832(1,5); 6,820(1,4); 6,812(0,8); 4,086(2,3); 4,068(6,9); 4,050(6,9); 4,032(2,3); 3,654(0,4); 3,629(1,1); 3,604(1,1); 3,579(0,4); 2,865(0,5); 2,855(1,4); 2,846(1,9); 2,837(2,8); 2,828(2,9); 2,819(2,0); 2,810(1,6); 2,803(0,9); 2,793(0,8); 2,785(0,5); 2,775(0,4); 2,624(0,3); 2,472(0,5); 2,467(0,9); 2,463(1,2); 2,458(0,8); 2,441(0,4); 2,264(0,4); 2,247(0,7); 2,228(0,6); 2,219(0,5); 2,146(384,3); 2,119(1,7); 2,113(2,8); 2,107(3,1); 2,101(2,1); 2,095(1,1); 2,064(0,4); 1,972(33,4); 1,964(28,1); 1,958(47,1); 1,952(213,3); 1,946(375,9); 1,940(492,1); 1,934(333,9); 1,927(168,7); 1,915(2,4); 1,780(1,1); 1,774(2,1); 1,768(2,8); 1,762(1,9); 1,756(0,9); 1,270(7,9); 1,233(0,3); 1,221(8,2); 1,204(16,0); 1,186(7,9); 1,135(3,7); 0,897(0,4); 0,882(1,2); 0,864(0,6); 0,789(1,6); 0,776(4,6); 0,771(6,0); 0,758(6,4); 0,752(5,2); 0,746(1,9); 0,741(2,2); 0,734(1,7); 0,728(1,2); 0,716(0,6); 0,598(2,1); 0,587(5,2); 0,581(5,3); 0,577(4,9); 0,572(4,9); 0,559(2,3); 0,547(1,2); 0,535(0,4); 0,146(0,9); 0,008(8,3); 0,000(214,0); -0,009(7,2); -0,150(0,9)$

35

Beispiel Ic-15:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,419(4,5); 8,416(4,7); 8,408(4,8); 8,404(4,7); 8,271(10,2); 8,115(0,4); 8,101(0,5); 8,071(4,5); 8,067(4,4); 8,050(5,0); 8,047(4,7); 7,994(12,7); 7,639(8,7); 7,634(11,6); 7,604(4,6); 7,598(3,4); 7,586(5,8); 7,583(6,2); 7,577(6,5); 7,575(6,0); 7,566(4,7); 7,554(4,5); 7,532(1,1); 7,490(0,5); 7,477(8,8); 7,456(6,4); 7,265(2,3); 7,260(1,3); 7,247(1,4); 7,242(2,6); 7,078(0,4); 7,074(0,4); 7,060(0,4); 6,925(0,6); 6,921(0,5); 6,902(1,6); 6,895(3,2); 6,882(3,4); 6,877(8,8); 5,448(0,6); 4,553(0,6); 4,540(0,6); 4,528(0,5); 4,086(2,2); 4,068(6,8); 4,050(6,9); 4,032(2,3); 3,304(0,4); 3,293(0,3); 2,731(14,4); 2,470(1,0); 2,465(1,4); 2,460(1,0); 2,456(0,5); 2,184(70,6); 2,120(2,5); 2,114(2,7); 2,108(2,9); 2,101(2,2); 2,095(1,5); 1,972(31,3); 1,964(16,3); 1,958(27,5); 1,952(124,2); 1,946(219,0); 1,940(287,2); 1,934(196,8); 1,928(101,3); 1,809(0,4); 1,781(0,9); 1,775(1,4); 1,769(1,8); 1,762(1,3); 1,756(0,8); 1,590(3,6); 1,576(9,3); 1,569(9,2); 1,561(2,7); 1,555(5,0); 1,547(4,9); 1,540(4,6); 1,526(2,4); 1,515(0,6); 1,486(0,4); 1,437(0,8); 1,387(0,6); 1,365(0,5); 1,347(4,9); 1,333(9,1); 1,326(10,6); 1,312(7,9); 1,304(4,9); 1,290(2,1); 1,272(0,9); 1,246(0,3); 1,221(8,1); 1,204(16,0); 1,186(7,9); 1,134(0,5); 0,146(1,1); 0,008(10,1); 0,000(253,8); -0,009(9,0); -0,150(1,1)$

40

45

Beispiel Ic-16:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 8,865(5,8); 8,584(6,2); 8,544(2,1); 8,533(2,2); 7,765(2,2); 7,756(3,5); 7,751(6,0); 7,551(3,1); 7,543(0,6); 7,537(0,6); 7,529(2,5); 4,113(1,2); 4,095(3,5); 4,077(3,6); 4,058(2,1); 4,039(3,4); 4,021(3,5); 4,003(1,2); 3,930(2,5); 3,324(5,6); 2,863(0,6); 2,854(0,9); 2,845(1,3); 2,836(1,2); 2,827(0,9); 2,817(0,6); 2,505(29,1); 2,503(29,9); 1,991(12,2); 1,989(14,3); 1,398(4,3); 1,332(4,4); 1,314(8,9); 1,297(5,5); 1,279(0,6); 1,196(3,2); 1,193(3,8); 1,178(6,2); 1,176(7,5); 1,160(3,3); 1,158(3,8); 1,072(13,8); 1,070(16,0); 0,734(0,8); 0,717(3,1); 0,704(3,0); 0,699(2,5); 0,688(0,9); 0,563(1,0); 0,553(3,2); 0,545(3,2); 0,537(2,6); 0,524(0,7); 0,008(1,3); 0,002(18,6); 0,000(21,9); -0,009(0,7)$

55

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5	<p>Beispiel Ic-17: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-d}_6)</math>:  <math>\delta = 9,123(0,9); 9,108(1,7); 9,093(0,9); 8,781(6,3); 8,538(7,0); 8,204(3,6); 7,878(1,8); 7,859(2,0); 7,836(1,8); 7,816(2,0); 7,569(1,9); 7,550(3,4); 7,531(1,6); 7,348(13,8); 7,337(9,0); 7,322(0,5); 7,315(0,6); 7,271(0,9); 7,263(1,1); 7,259(1,2); 7,250(1,5); 7,244(0,7); 7,238(0,8); 7,228(0,4); 4,532(4,6); 4,517(4,5); 4,057(0,8); 4,039(2,3); 4,021(2,3); 4,003(0,9); 3,826(16,0); 3,328(19,3); 2,512(13,5); 2,507(26,7); 2,503(34,6); 2,498(24,7); 2,494(11,9); 1,990(10,1); 1,194(2,6); 1,176(5,3); 1,158(2,6); 0,008(0,4); 0,000(8,7)</math></p>
10	<p>Beispiel Ic-18: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-d}_6)</math>:  <math>\delta = 8,774(6,3); 8,527(7,1); 8,500(1,8); 8,490(1,8); 8,087(3,6); 7,844(1,7); 7,825(2,0); 7,736(1,7); 7,717(2,1); 7,533(2,0); 7,513(3,5); 7,494(1,5); 3,877(1,2); 3,825(16,0); 3,325(29,1); 2,887(0,6); 2,877(0,9); 2,868(1,4); 2,859(1,4); 2,850(0,9); 2,841(0,7); 2,525(0,8); 2,511(16,4); 2,507(32,9); 2,503(43,5); 2,498(31,6); 2,494(15,5); 1,989(0,5); 0,745(0,8); 0,732(2,3); 0,727(3,3); 0,715(3,0); 0,709(2,6); 0,698(1,1); 0,606(1,2); 0,595(3,4); 0,588(2,9); 0,585(2,9); 0,579(2,5); 0,567(0,8); 0,008(0,3); 0,000(9,3); -0,008(0,4)</math></p>
15	<p>Beispiel Ic-19: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-d}_6)</math>:  <math>\delta = 9,391(3,4); 8,796(5,8); 8,543(6,2); 8,542(6,3); 8,316(0,3); 8,138(2,2); 8,134(3,5); 8,130(2,0); 7,914(1,6); 7,910(1,2); 7,897(1,4); 7,893(1,7); 7,891(1,3); 7,764(1,7); 7,744(1,9); 7,582(1,9); 7,563(3,2); 7,543(1,4); 4,057(1,2); 4,039(3,6); 4,021(3,6); 4,003(1,2); 3,877(2,3); 3,829(14,6); 3,326(22,8); 2,526(0,7); 2,512(14,0); 2,508(28,4); 2,503(37,4); 2,499(26,7); 2,494(12,6); 1,990(16,0); 1,613(1,5); 1,599(3,5); 1,592(3,7); 1,579(1,7); 1,323(1,8); 1,309(3,5); 1,303(3,7); 1,288(1,4); 1,194(4,3); 1,176(8,4); 1,158(4,1); 0,008(0,3); 0,000(9,4)</math></p>
20	<p>Beispiel Ic-20: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-d}_6)</math>:  <math>\delta = 9,218(0,9); 9,203(1,8); 9,188(0,9); 8,780(6,2); 8,531(6,8); 8,178(3,6); 7,877(1,8); 7,857(2,0); 7,810(1,8); 7,791(2,1); 7,566(1,9); 7,546(3,3); 7,527(1,5); 7,403(2,4); 7,400(2,5); 7,391(2,7); 7,388(2,5); 7,052(2,1); 7,044(2,7); 6,983(2,4); 6,975(2,2); 6,971(2,4); 6,962(1,9); 4,679(4,4); 4,664(4,4); 4,056(0,4); 4,039(1,4); 4,021(1,4); 4,003(0,5); 3,874(0,4); 3,825(16,0); 3,325(27,3); 2,671(0,3); 2,507(39,1); 2,503(49,7); 2,498(36,2); 1,989(6,1); 1,193(1,6); 1,175(3,1); 1,158(1,5);</math></p>
25	<p><math>0,008(0,4); 0,000(8,3)</math></p>
30	<p>Beispiel Ic-21: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-d}_6)</math>:  <math>\delta = 9,452(3,6); 8,886(4,9); 8,595(5,5); 7,831(0,9); 7,825(2,4); 7,819(3,4); 7,814(3,7); 7,808(2,8); 7,803(1,1); 7,601(3,3); 7,590(0,8); 7,578(2,8); 4,113(0,9); 4,095(2,9); 4,077(2,9); 4,057(2,1); 4,039(3,7); 4,021(3,8); 4,004(1,3); 3,929(0,7); 3,324(4,7); 2,525(0,4); 2,512(7,4); 2,508(14,8); 2,503(19,5); 2,499(14,0); 2,494(6,7); 1,990(16,0); 1,623(1,3); 1,609(3,0); 1,602(3,2); 1,589(1,4); 1,398(5,5); 1,334(4,2); 1,316(8,9); 1,297(4,8); 1,290(1,7); 1,276(3,0); 1,269(3,2); 1,255(1,2); 1,194(4,3); 1,176(8,3); 1,158(4,1); 1,071(4,4); 0,008(0,7); 0,000(19,1); -0,009(0,7)</math></p>
35	<p>Beispiel Ic-22: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetonitril-d}_3)</math>:  <math>\delta = 9,201(0,8); 8,295(5,7); 8,273(5,2); 7,897(3,5); 7,891(3,6); 7,766(2,4); 7,760(2,2); 7,745(2,7); 7,739(2,6); 7,586(4,0); 7,565(3,2); 4,086(0,7); 4,068(2,3); 4,050(2,3); 4,032(0,8); 3,935(0,6); 3,756(16,0); 3,391(0,4); 3,376(0,9); 2,468(0,5); 2,463(0,7); 2,459(0,5); 2,181(101,9); 2,120(0,5); 2,114(0,6); 2,108(0,7); 2,102(0,6); 1,972(10,5); 1,965(6,5); 1,959(10,4); 1,953(46,5); 1,947(81,4); 1,941(106,1); 1,934(71,9); 1,928(36,5); 1,915(0,6); 1,775(0,5); 1,769(0,6); 1,763(0,4); 1,566(0,4); 1,559(0,5); 1,552(1,1); 1,545(0,5); 1,537(0,4); 1,340(0,5); 1,310(0,4); 1,285(0,9); 1,271(1,8); 1,222(2,7); 1,204(5,3); 1,186(2,6); 0,882(0,4); 0,080(1,2); 0,008(2,1); 0,000(57,3); -0,009(1,7)</math></p>
40	<p>Beispiel Ic-23: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-d}_6)</math>:  <math>\delta = 9,248(1,0); 9,232(2,2); 9,216(1,0); 8,844(6,3); 8,581(7,1); 7,833(1,8); 7,827(2,1); 7,812(2,1); 7,807(2,7); 7,776(4,6); 7,771(3,6); 7,608(4,5); 7,587(3,8); 4,144(0,5); 4,128(0,7); 4,120(1,8); 4,104(1,8); 4,096(1,9); 4,080(1,8); 4,072(0,7); 4,056(1,4); 4,039(2,4); 4,021(2,4); 4,003(0,9); 3,823(16,0); 3,321(6,5); 2,891(0,7); 2,732(0,6); 2,524(0,8); 2,511(17,4); 2,507(35,0); 2,502(45,7); 2,498(32,5); 2,493(15,4); 1,989(10,6); 1,193(2,8); 1,175(5,5); 1,158(2,7); 0,008(1,0); 0,000(28,3); -0,009(0,9)</math></p>
45	<p>Beispiel Ic-24: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-d}_6)</math>:</p>
50	
55	

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 8,886(5,3); 8,644(2,1); 8,631(7,2); 7,913(1,6); 7,908(1,7); 7,887(1,7); 7,882(1,7); 7,652(2,9); 7,650(2,9); 4,056(1,2); 4,038(3,7); 4,021(3,7); 4,003(1,3); 3,839(0,7); 3,825(13,8); 3,321(6,3); 2,868(0,5); 2,858(0,8); 2,850(1,2); 2,840(1,2); 2,831(0,8); 2,822(0,6); 2,506(30,6); 2,502(39,4); 2,498(28,8); 1,989(16,0); 1,236(0,5); 1,193(4,2); 1,175(8,3); 1,158(4,1); 0,748(0,8); 0,735(2,3); 0,730(3,0); 0,718(2,9); 0,712(2,4); 0,701(1,0); 0,567(1,0); 0,556(3,0); 0,550(2,9); 0,546(2,7); 0,540(2,5); 0,528(0,7); 0,000(12,1); -0,008(0,5)$

10

Beispiel Ic-25:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 10,722(3,2); 8,860(4,7); 8,619(5,0); 7,997(2,8); 7,992(3,1); 7,866(1,4); 7,860(1,4); 7,844(1,7); 7,839(1,7); 7,784(3,9); 7,761(4,5); 7,650(3,0); 7,629(2,5); 7,443(4,5); 7,421(4,1); 3,828(13,0);$

$3,320(41,4); 2,670(1,1); 2,541(0,6); 2,501(168,7); 2,498(131,8); 2,328(1,1); 1,398(16,0); 0,000(2,0)$

15

Beispiel Ic-26:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 8,814(4,6); 8,537(4,5); 7,953(2,0); 7,786(1,6); 7,710(0,8); 7,690(0,9); 7,495(1,5); 7,475(1,3); 4,056(0,4); 4,038(1,3); 4,020(1,3); 4,002(0,5); 3,822(13,1); 3,323(38,8); 3,074(2,3); 2,891(16,0); 2,732(13,2); 2,731(12,5); 2,675(0,4); 2,671(0,6); 2,666(0,4); 2,524(1,4); 2,511(32,4); 2,507(65,4); 2,502(85,2); 2,497(59,7); 2,493(27,6); 2,333(0,4); 2,329(0,5); 2,324(0,4); 1,989(5,8); 1,236(0,4); 1,193(1,6); 1,175(3,2); 1,157(1,6); 0,008(0,6); 0,000(16,0); -0,009(0,5)$

20

Beispiel Ic-27:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 9,558(4,5); 8,902(6,2); 8,639(6,9); 7,981(1,9); 7,976(2,0); 7,955(1,9); 7,950(1,9); 7,716(3,2); 7,714(3,2); 4,056(0,9); 4,039(2,7); 4,021(2,7); 4,003(1,0); 3,824(16,0); 3,773(0,6); 3,322(9,6); 2,525(0,7); 2,511(17,1); 2,507(35,1); 2,502(46,3); 2,498(33,3); 2,494(16,1); 1,989(11,8); 1,638(1,6); 1,624(3,9); 1,617(4,1); 1,603(1,8); 1,298(1,9); 1,284(3,8); 1,278(4,1); 1,263(1,5); 1,193(3,1); 1,175(6,2); 1,158(3,1); 0,000(0,9)$

25

Beispiel Ic-28:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,273(5,4); 8,246(5,0); 7,731(3,3); 7,725(4,0); 7,690(2,1); 7,684(1,6); 7,669(2,5); 7,663(2,0); 7,514(3,9); 7,494(3,1); 7,462(0,6); 7,446(0,6); 5,447(0,5); 5,337(0,8); 5,316(1,6); 5,295(1,7); 5,274(0,9); 4,068(0,9); 4,050(0,9); 3,752(16,0); 3,546(2,2); 3,542(1,3); 3,522(4,0); 3,503(1,7); 3,500(2,8); 3,375(2,9); 3,372(1,6); 3,355(4,1); 3,352(3,7); 3,335(1,3); 3,331(2,2); 2,463(0,4); 2,151(108,1); 2,120(0,5); 2,114(0,8); 2,107(0,9); 2,101(0,6); 2,095(0,3); 1,972(4,8); 1,964(8,9); 1,958(14,9); 1,952(64,2); 1,946(112,1); 1,940(145,5); 1,934(99,3); 1,928(50,3); 1,915(0,8); 1,781(0,4); 1,775(0,6); 1,768(0,8); 1,762(0,6); 1,437(2,7); 1,222(1,1); 1,204(2,2); 1,186(1,1); 0,146(1,4); 0,008(14,3); 0,000(296,2); -0,009(10,2); -0,150(1,4)$

30

Beispiel Ic-29:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 9,025(4,4); 8,775(6,2); 8,541(6,8); 8,012(3,7); 8,007(3,7); 7,782(1,9); 7,776(1,7); 7,761(2,3); 7,755(2,1); 7,557(4,1); 7,536(3,4); 7,325(1,7); 7,072(1,7); 3,821(16,0); 3,327(34,7); 2,507(39,2); 2,502(48,5); 2,498(35,1); 2,075(0,6); 1,358(1,6); 1,348(3,9); 1,339(4,3); 1,330(1,7); 1,006(1,8); 0,996(4,1); 0,987(4,0); 0,977(1,5); 0,008(2,2); 0,000(44,4); -0,008(2,1)$

35

Beispiel Ic-30:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 9,860(0,8); 8,997(5,9); 8,658(6,0); 8,568(1,8); 8,557(1,8); 7,836(6,8); 7,815(2,3); 7,810(1,6); 7,575(2,8); 7,555(2,5); 7,239(0,4); 7,217(0,4); 6,724(0,5); 6,716(0,4); 4,065(16,0); 3,325(110,7); 2,871(0,5); 2,861(0,7); 2,852(1,1); 2,842(1,2); 2,833(0,7); 2,824(0,6); 2,675(0,5); 2,671(0,7); 2,666(0,6); 2,541(0,5); 2,510(42,7); 2,506(86,2); 2,502(114,9); 2,497(84,6); 2,493(42,7); 2,333(0,5); 2,328(0,7); 2,324(0,6); 0,739(0,8); 0,726(2,2); 0,721(3,0); 0,709(2,8); 0,703(2,3); 0,692(1,1);$

45

$0,679(0,3); 0,674(0,4); 0,662(0,4); 0,656(0,3); 0,565(1,0); 0,555(3,0); 0,548(2,7); 0,545(2,6); 0,539(2,5); 0,527(0,8); 0,503(0,4); 0,497(0,4); 0,492(0,4); 0,487(0,4); 0,008(1,2); 0,000(32,1); -0,008(1,5)$

50

Beispiel Ic-31:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,268(5,6); 8,248(5,0); 7,812(3,6); 7,806(3,9); 7,713(1,9); 7,707(1,7); 7,692(2,4); 7,686(2,2); 7,541(4,1); 7,520(3,2); 7,296(0,7); 7,069(0,5); 4,068(0,7); 4,051(7,3); 4,036(6,9); 3,988(0,8); 3,972(0,9); 3,964(2,5); 3,948(2,5); 3,941(2,6); 3,924(2,5); 3,917(0,9); 3,900(0,9); 3,753(16,0); 2,143(19,9); 2,113(0,4); 2,107(0,5); 2,086(0,4); 1,972(3,0); 1,964(4,0); 1,958(6,4); 1,952(30,1); 1,946(53,3); 1,940(70,0); 1,934(47,9); 1,927(24,6); 1,915(0,5); 1,768(0,6); 1,437(0,5); 1,271(1,2); 1,221(0,8); 1,204(1,5); 1,186(0,7); 0,008(0,7); 0,000(23,0); -0,009(0,8)$

55

Beispiel Ic-32:  $^1\text{H-NMR}(601,6 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 8,2654(5,3); 8,2647(5,7); 8,241(5,2); 7,690(8,1); 7,687(3,9); 7,679(3,4); 7,676(1,9); 7,514(3,6); 7,509(1,1); 7,503(0,9); 7,499(3,0); 7,463(1,5); 3,750(16,0); 2,136(109,3); 2,059(0,6); 2,055(1,0); 2,051(1,5); 2,047(1,0); 2,043(0,5); 1,965(5,7); 1,956(15,3); 1,952(19,2); 1,948(105,0); 1,944(179,4); 1,940(265,5); 1,936(186,2); 1,932(95,2); 1,834(0,6); 1,830(1,0); 1,826(1,5); 1,821(1,0); 1,817(0,5); 1,396(1,5); 1,386(3,7); 1,382(4,0); 1,373(2,1); 1,270(0,3); 1,252(1,0); 1,242(3,2); 1,231(0,7); 0,005(2,1); 0,000(72,1); -0,006(3,0)$

10

Beispiel Ic-34:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,273(5,5); 8,254(5,0); 7,704(3,5); 7,699(3,9); 7,693(2,6); 7,673(4,6); 7,628(3,0); 7,622(2,5); 7,607(1,7); 7,601(1,7); 7,587(1,2); 3,750(16,0); 3,696(0,5); 2,463(0,4); 2,154(180,4); 2,120(0,5); 2,114(0,7); 2,108(1,0); 2,101(0,7); 2,095(0,3); 1,964(5,4); 1,958(12,6); 1,953(67,6); 1,946(121,1); 1,940(161,6); 1,934(110,1); 1,928(56,0); 1,915(0,6); 1,781(0,3); 1,775(0,6); 1,769(0,9); 1,763(0,6); 1,603(1,6); 1,589(4,0); 1,582(3,9); 1,569(2,1); 1,371(2,2); 1,358(3,9); 1,351(4,0); 1,336(1,7); 1,270(0,4); 1,135(2,3); 0,146(1,5); 0,008(11,8); 0,000(330,0); -0,009(11,1); -0,150(1,4)$

15

Beispiel Ic-35:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 8,776(6,1); 8,537(6,7); 8,193(3,6); 8,040(1,6); 7,859(1,7); 7,840(1,9); 7,807(1,8); 7,787(2,0); 7,627(0,6); 7,624(0,5); 7,616(0,4); 7,598(0,5); 7,575(0,4); 7,566(0,4); 7,557(0,3); 7,548(0,4); 7,541(2,0); 7,522(3,4); 7,502(1,6); 7,467(1,6); 4,056(1,0); 4,038(3,0); 4,020(3,0); 4,002(1,0); 3,831(16,0); 3,325(59,5); 2,676(0,4); 2,671(0,6); 2,667(0,4); 2,542(0,4); 2,525(1,6); 2,511(34,4); 2,507(69,7); 2,502(91,5); 2,498(65,4); 2,494(31,3); 2,334(0,4); 2,329(0,6); 2,325(0,4); 1,989(13,1); 1,193(3,5); 1,175(7,0); 1,157(3,4); 0,000(3,4)$

20

Beispiel Ic-36:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 9,360(3,6); 8,798(6,0); 8,547(6,6); 7,935(1,5); 7,930(2,0); 7,919(1,6); 7,913(2,6); 7,905(0,9);$

25

$7,899(1,3); 7,890(1,2); 7,884(1,0); 7,878(1,1); 7,872(0,8); 7,430(1,7); 7,408(1,9); 7,405(2,0); 7,383(1,5); 4,056(0,9); 4,038(2,9); 4,020(2,9); 4,002(1,0); 3,930(1,4); 3,821(16,0); 3,325(85,1); 2,676(0,5); 2,671(0,6); 2,667(0,5); 2,541(0,4); 2,524(2,0); 2,511(38,5); 2,507(75,2); 2,502(96,7); 2,498(68,6); 2,493(32,4); 2,333(0,4); 2,329(0,6); 2,324(0,4); 1,989(12,5); 1,612(1,6); 1,598(4,1); 1,591(4,2); 1,577(1,9); 1,300(2,0); 1,287(4,1); 1,280(4,3); 1,266(1,6); 1,193(3,4); 1,175(6,8); 1,157(3,4); 1,069(9,3); 0,008(2,0); 0,000(47,1); -0,009(1,7)$

30

Beispiel Ic-37:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 8,773(4,0); 8,530(4,5); 8,480(1,1); 8,470(1,1); 7,853(0,9); 7,847(1,4); 7,837(1,5); 7,831(1,8); 7,826(1,1); 7,817(0,8); 7,811(0,6); 7,805(0,7); 7,799(0,5); 7,371(1,1); 7,350(1,2); 7,347(1,2); 7,325(1,0); 4,038(0,7); 4,020(0,7); 3,930(2,7); 3,820(10,3); 3,740(0,3); 3,325(20,2); 2,877(0,4); 2,868(0,6); 2,859(0,9); 2,849(0,9); 2,840(0,5); 2,831(0,4); 2,524(0,6); 2,511(12,1); 2,507(23,8); 2,502(30,9); 2,498(22,0); 2,493(10,3); 1,989(3,0); 1,193(0,8); 1,175(1,6); 1,158(0,8); 1,069(16,0); 0,735(0,6); 0,722(1,6); 0,717(2,2); 0,705(2,1); 0,699(1,7); 0,688(0,7); 0,572(0,8); 0,561(2,3); 0,555(2,0); 0,551(1,8); 0,545(1,8); 0,533(0,5); 0,000(7,0)$

35

Beispiel Ic-50:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 9,117(4,9); 8,273(5,8); 8,211(5,5); 8,164(0,9); 8,144(0,9); 7,921(4,1); 7,698(3,0); 7,693(3,8); 7,678(0,4); 7,664(2,4); 7,659(1,9); 7,643(2,3); 7,637(1,9); 7,610(0,5); 7,605(0,4); 7,487(3,6); 7,477(0,8); 7,467(2,8); 7,456(0,5); 7,393(0,6); 6,914(1,2); 5,447(1,0); 3,893(0,3); 3,860(2,7); 3,785(16,0); 2,875(0,7); 2,866(1,0); 2,857(1,5); 2,848(1,5); 2,839(1,0); 2,830(0,7); 2,139(99,1); 2,114(1,1); 2,108(1,2); 2,102(0,7); 1,964(5,8); 1,958(12,0); 1,952(50,9); 1,946(90,3); 1,940(118,8); 1,934(83,1); 1,928(43,5); 1,775(0,5); 1,768(0,7); 1,762(0,5); 1,135(1,1); 0,800(0,8); 0,787(2,8); 0,782(3,6); 0,770(3,7); 0,765(2,9); 0,753(1,3); 0,617(1,1); 0,606(3,2); 0,600(3,4); 0,591(3,0); 0,579(0,9); 0,008(2,0); 0,000(45,8)$

45

Beispiel Ic-51:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,292(3,8); 8,214(3,7); 8,186(0,7); 8,122(0,6); 7,925(3,0); 7,693(2,2); 7,688(2,8); 7,659(1,5); 7,654(1,1); 7,638(1,6); 7,633(1,5); 7,483(2,7); 7,463(2,1); 7,385(0,6); 6,911(0,9); 3,859(2,0); 3,798(11,7); 3,760(16,0); 3,514(2,7); 2,872(0,5); 2,863(0,7); 2,854(1,2); 2,845(1,2); 2,835(0,8); 2,827(0,5); 2,463(0,4); 2,228(0,4); 2,145(185,3); 2,114(1,8); 2,108(2,0); 2,101(1,4); 2,095(0,8); 1,964(12,8); 1,958(26,5); 1,952(118,4); 1,946(212,5); 1,940(281,9); 1,934(199,0); 1,928(105,1); 1,781(0,6); 1,775(1,2); 1,769(1,5); 1,762(1,2); 1,756(0,5); 1,271(0,6); 0,798(0,6); 0,781(2,6); 0,769(2,6); 0,764(2,2); 0,751(1,0); 0,611(0,8); 0,599(2,4); 0,593(2,6); 0,583(2,1); 0,571(0,6); 0,146(0,4); 0,008(3,2); 0,000(82,9); -0,149(0,4)$

50

Beispiel Ic-52:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 9,797(4,1); 8,403(5,2); 8,297(0,4); 8,285(4,9); 7,720(3,0); 7,715(3,6); 7,683(1,9); 7,678(1,5);$

55

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5	7,663(2,4); 7,657(1,9); 7,617(0,3); 7,613(0,4); 7,520(0,4); 7,513(0,4); 7,501(3,4); 7,480(2,7); 6,943(0,9); 3,892(16,0); 3,777(0,4); 2,876(0,6); 2,867(0,9); 2,858(1,3); 2,849(1,3); 2,840(0,9); 2,831(0,6); 2,464(0,4); 2,155(193,5); 2,120(0,6); 2,114(0,8); 2,107(0,9); 2,101(0,7); 2,095(0,4); 1,964(7,5); 1,958(15,2); 1,952(61,4); 1,946(107,2); 1,940(139,4); 1,934(95,6); 1,928(48,9); 1,781(0,4); 1,775(0,6); 1,768(0,8); 1,762(0,6); 0,801(0,7); 0,787(2,2); 0,783(2,9); 0,770(2,9); 0,765(2,3); 0,753(1,0); 0,616(1,0); 0,604(2,7); 0,599(2,8); 0,595(2,5); 0,589(2,4); 0,577(0,7); 0,146(0,3); 0,008(4,0); 0,000(75,6); -0,009(3,5); -0,150(0,4)
10	Beispiel Ic-53: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): $\delta = 9,477(3,7); 9,018(5,8); 8,669(5,9); 8,316(0,3); 7,892(7,5); 7,889(3,1); 7,875(2,4); 7,869(1,5); 7,627(2,6); 7,622(1,2); 7,608(1,1); 7,604(2,3); 4,063(16,0); 3,323(62,1); 2,675(0,5); 2,671(0,6); 2,666(0,5); 2,541(0,5); 2,506(74,2); 2,502(94,3); 2,497(67,8); 2,333(0,5); 2,329(0,6); 2,324(0,5); 1,989(0,3); 1,630(1,3); 1,616(3,5); 1,609(3,6); 1,596(1,5); 1,289(1,6); 1,276(3,4); 1,269(3,6); 1,255(1,3); 0,000(0,5)$
15	Beispiel Ic-65: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): $\delta = 9,527(1,6); 9,038(2,1); 8,736(2,3); 8,235(1,2); 8,214(1,5); 8,068(0,8); 8,063(0,8); 8,047(0,6); 8,042(0,7); 7,976(1,4); 7,971(1,3); 4,056(0,4); 4,038(1,2); 4,021(1,2); 4,003(0,4); 3,931(2,2); 3,838(5,5); 3,326(12,2); 2,511(6,4); 2,507(12,7); 2,503(16,5); 2,498(11,9); 2,494(5,8); 1,989(5,0); 1,630(0,5); 1,616(1,3); 1,609(1,4); 1,596(0,6); 1,398(1,7); 1,292(0,6); 1,279(1,3); 1,272(1,4); 1,257(0,5); 1,193(1,4); 1,176(2,7); 1,158(1,3); 1,069(16,0); 0,008(0,6); 0,000(16,4); -0,009(0,6)$
20	Beispiel Ic-66: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): $\delta = 9,005(2,0); 8,718(2,2); 8,683(0,7); 8,673(0,7); 8,158(1,2); 8,137(1,5); 8,005(0,8); 8,000(0,8); 7,984(0,6); 7,979(0,7); 7,922(1,4); 7,917(1,2); 4,038(0,9); 4,020(0,9); 3,930(2,2); 3,836(5,1); 3,325(22,5); 2,807(0,5); 2,797(0,5); 2,524(0,5); 2,511(10,2); 2,507(20,8); 2,502(27,4); 2,498(19,6); 2,493(9,3); 1,989(3,8); 1,193(1,0); 1,175(2,1); 1,157(1,0); 1,069(16,0); 0,733(0,8); 0,727(1,1); 0,715(1,1); 0,709(0,9); 0,698(0,4); 0,563(0,4); 0,553(1,1); 0,547(1,0); 0,543(0,9); 0,537(0,9); 0,008(1,0); 0,000(26,7); -0,009(1,0)$
25	Beispiel Ic-67: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): $\delta = 8,969(3,4); 8,714(5,1); 8,475(5,5); 7,928(3,2); 7,922(3,5); 7,835(1,6); 7,829(1,4); 7,814(1,7); 7,808(1,6); 7,222(2,8); 7,201(2,6); 4,056(0,5); 4,038(1,6); 4,021(1,7); 4,003(0,6); 3,889(16,0); 3,820(13,5); 3,326(23,9); 2,525(0,7); 2,511(13,3); 2,507(26,5); 2,503(34,6); 2,498(24,8); 2,494(11,9); 1,989(6,9); 1,583(1,3); 1,568(3,4); 1,561(3,5); 1,548(1,5); 1,398(4,0); 1,292(1,6); 1,278(3,4); 1,271(3,6); 1,257(1,3); 1,193(1,9); 1,176(3,7); 1,158(1,8); 1,070(0,9); 0,008(1,3); 0,000(35,8); -0,009(1,3)$
30	Beispiel Ic-68: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): $\delta = 8,691(5,5); 8,455(5,4); 8,152(2,6); 7,861(4,6); 7,771(2,3); 7,750(2,4); 7,183(2,8); 7,161(2,6); 4,055(0,8); 4,038(2,2); 4,021(2,2); 4,002(0,8); 3,931(1,7); 3,868(16,0); 3,818(15,8); 3,326(30,3); 2,850(1,6); 2,844(1,6); 2,672(0,4); 2,503(62,6); 2,329(0,4); 1,989(8,5); 1,398(4,8); 1,192(2,3); 1,175(4,5); 1,157(2,2); 1,069(10,3); 0,708(4,3); 0,692(4,3); 0,550(5,3); 0,000(26,4); -0,001(26,4)$
35	Beispiel Ic-69: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, Acetonitril-d <sub>3</sub> ): $\delta = 8,284(5,9); 8,223(5,4); 7,704(3,2); 7,699(4,0); 7,667(2,1); 7,662(1,6); 7,647(2,4); 7,641(2,0); 7,488(3,8); 7,467(3,0); 6,920(0,8); 6,835(0,4); 4,414(4,5); 4,400(4,6); 4,085(0,9); 4,068(2,7); 4,050(2,8); 4,032(0,9); 3,807(16,0); 3,288(0,8); 3,276(1,2); 3,262(0,5); 2,875(0,7); 2,865(1,0); 2,857(1,5); 2,847(1,5); 2,838(1,0); 2,829(0,7); 2,145(49,0); 2,113(0,3); 2,107(0,4); 1,972(12,3); 1,964(2,3); 1,958(5,1); 1,952(26,0); 1,946(46,8); 1,940(62,5); 1,934(42,9); 1,927(22,0); 1,768(0,4); 1,437(7,1); 1,269(0,4); 1,221(3,2); 1,204(6,3); 1,186(3,1); 1,135(0,6); 0,799(0,8); 0,787(2,4); 0,782(3,2); 0,769(3,3); 0,764(2,5); 0,752(1,2); 0,615(1,1); 0,604(2,8); 0,598(2,9); 0,594(2,6); 0,588(2,5); 0,576(0,8); 0,146(0,9); 0,008(8,0); 0,000(197,8); -0,009(8,4); -0,150(0,9)$
40	Beispiel Ic-77: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): $\delta = 8,831(6,1); 8,793(1,0); 8,778(2,0); 8,765(1,0); 8,575(6,6); 8,317(0,5); 7,795(1,4); 7,790(2,5); 7,779(3,7); 7,774(7,8); 7,576(3,4); 7,570(0,9); 7,560(0,8); 7,554(2,8); 4,619(1,5); 4,606(3,0); 4,594(1,6); 4,500(1,5); 4,488(3,0); 4,475(1,6); 4,056(0,6); 4,038(1,7); 4,020(1,7); 4,002(0,6); 3,823(16,0); 3,611(0,8); 3,598(1,9); 3,585(1,9); 3,572(0,7); 3,544(0,8); 3,531(2,0); 3,518(1,9); 3,505(0,7); 3,324(44,7); 2,675(0,3); 2,671(0,4); 2,667(0,3); 2,506(55,0); 2,502(68,1); 2,498(49,4); 2,329(0,4); 2,324(0,3); 1,989(7,1); 1,193(1,9); 1,175(3,7); 1,157(1,8); 0,146(0,3); 0,008(3,2); 0,000(71,0); -0,008(3,5); -0,150(0,4)$
45	Beispiel Ic-78: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ):
50	
55	

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5	<p><math>\delta = 8,967(1,0); 8,952(2,0); 8,937(1,0); 8,830(6,2); 8,570(6,7); 7,815(1,6); 7,809(2,2); 7,794(1,5); 7,788(3,8); 7,783(5,0); 7,778(2,8); 7,592(3,8); 7,572(3,2); 6,278(0,4); 6,268(0,8); 6,259(0,4); 6,139(0,8); 6,129(1,7); 6,119(0,8); 5,999(0,4); 5,990(0,9); 5,980(0,4); 4,038(0,4); 4,020(0,4); 3,822(16,0); 3,733(0,6); 3,723(0,8); 3,718(0,8); 3,708(0,7); 3,693(1,4); 3,684(1,6); 3,679(1,6); 3,669(1,4); 3,654(0,7); 3,644(0,8); 3,640(0,9); 3,629(0,7); 3,325(36,0); 2,525(0,8); 2,511(17,4); 2,507(35,4); 2,502(46,5); 2,498(33,5); 2,493(16,2); 1,989(1,7); 1,398(1,4); 1,193(0,5); 1,175(0,9); 1,157(0,4); 0,008(2,2); 0,000(58,2); -0,009(2,2)</math></p>
10	<p>Beispiel Ic-79: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,839(0,4); 8,822(6,1); 8,604(0,4); 8,575(6,8); 8,507(2,0); 8,496(2,0); 7,767(1,3); 7,762(2,7); 7,754(3,9); 7,748(5,4); 7,745(4,3); 7,740(1,2); 7,545(4,0); 7,536(0,7); 7,532(0,6); 7,523(3,3); 4,056(0,6); 4,038(1,7); 4,020(1,8); 4,002(0,6); 3,838(0,9); 3,820(16,0); 3,324(57,4); 2,675(0,4);</math></p>
15	<p><math>2,671(0,5); 2,667(0,4); 2,566(0,4); 2,556(1,1); 2,547(1,5); 2,537(1,6); 2,525(1,7); 2,511(28,1); 2,506(57,0); 2,502(75,0); 2,497(53,8); 2,493(25,8); 2,333(0,4); 2,329(0,5); 2,324(0,3); 1,989(7,5); 1,193(2,0); 1,175(4,0); 1,157(2,0); 1,065(8,3); 1,050(10,9); 0,951(0,5); 0,943(0,6); 0,936(0,7); 0,929(1,0); 0,921(0,8); 0,914(1,0); 0,906(0,8); 0,899(0,6); 0,890(0,5); 0,723(0,9); 0,711(1,4); 0,700(1,8); 0,689(1,2); 0,678(0,8); 0,538(0,5); 0,519(1,1); 0,505(1,5); 0,501(1,2); 0,492(1,1); 0,487(1,5); 0,473(0,7); 0,146(0,4); 0,015(0,4); 0,008(3,2); 0,000(91,2); -0,009(3,4); -0,150(0,4)</math></p>
20	<p>Beispiel Ic-80: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,999(1,0); 8,984(2,0); 8,968(1,0); 8,839(6,1); 8,582(6,8); 7,812(1,6); 7,806(2,0); 7,791(1,8); 7,786(2,8); 7,770(4,5); 7,765(3,1); 7,590(4,1); 7,569(3,4); 4,056(1,0); 4,038(2,9); 4,021(2,9); 4,003(1,1); 3,824(16,0); 3,754(1,0); 3,738(1,0); 3,720(2,1); 3,704(2,1); 3,686(1,1); 3,670(1,0); 3,325(21,8); 2,507(27,1); 2,502(34,9); 2,498(25,0); 1,989(12,4); 1,731(3,5); 1,683(7,8); 1,636(3,9); 1,193(3,3); 1,175(6,5); 1,158(3,2); 0,008(2,0); 0,000(47,1); -0,009(1,8)</math></p>
25	<p>Beispiel Ic-81: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,815(6,0); 8,603(1,7); 8,598(1,8); 8,569(6,6); 8,316(0,7); 7,789(8,6); 7,770(2,8); 7,764(1,8); 7,569(2,9); 7,548(2,4); 4,832(0,7); 4,829(0,7); 4,824(0,8); 4,822(0,7); 4,815(0,8); 4,807(0,7); 4,673(0,7); 4,668(0,8); 4,659(0,8); 4,656(0,8); 4,651(0,7); 4,038(0,6); 4,020(0,6); 3,838(0,5); 3,820(16,0); 3,324(38,9); 3,300(0,5); 3,249(0,3); 3,238(0,6); 3,226(0,6); 3,224(0,6); 3,213(0,8); 3,199(0,8); 3,188(0,6); 3,174(0,6); 3,163(0,3); 2,675(0,4); 2,671(0,5); 2,667(0,3); 2,506(55,1); 2,502(70,3); 2,497(51,1); 2,333(0,3); 2,329(0,4); 2,324(0,3); 1,989(2,6); 1,472(0,4); 1,464(0,5); 1,453(0,6); 1,445(0,8); 1,439(0,6); 1,428(0,5); 1,420(0,6); 1,412(0,6); 1,404(0,7); 1,398(2,2); 1,393(0,8); 1,387(0,8); 1,379(0,6); 1,368(0,5); 1,359(0,5); 1,193(0,7); 1,175(1,4); 1,157(0,7); 1,051(0,5); 1,034(0,9); 1,020(1,1); 1,004(1,0); 1,001(1,0); 0,990(0,8); 0,987(0,8); 0,970(0,5); 0,146(0,4); 0,008(3,7); 0,000(84,3); -0,008(4,3); -0,150(0,4)</math></p>
30	<p>Beispiel Ic-81: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,815(6,0); 8,603(1,7); 8,598(1,8); 8,569(6,6); 8,316(0,7); 7,789(8,6); 7,770(2,8); 7,764(1,8); 7,569(2,9); 7,548(2,4); 4,832(0,7); 4,829(0,7); 4,824(0,8); 4,822(0,7); 4,815(0,8); 4,807(0,7); 4,673(0,7); 4,668(0,8); 4,659(0,8); 4,656(0,8); 4,651(0,7); 4,038(0,6); 4,020(0,6); 3,838(0,5); 3,820(16,0); 3,324(38,9); 3,300(0,5); 3,249(0,3); 3,238(0,6); 3,226(0,6); 3,224(0,6); 3,213(0,8); 3,199(0,8); 3,188(0,6); 3,174(0,6); 3,163(0,3); 2,675(0,4); 2,671(0,5); 2,667(0,3); 2,506(55,1); 2,502(70,3); 2,497(51,1); 2,333(0,3); 2,329(0,4); 2,324(0,3); 1,989(2,6); 1,472(0,4); 1,464(0,5); 1,453(0,6); 1,445(0,8); 1,439(0,6); 1,428(0,5); 1,420(0,6); 1,412(0,6); 1,404(0,7); 1,398(2,2); 1,393(0,8); 1,387(0,8); 1,379(0,6); 1,368(0,5); 1,359(0,5); 1,193(0,7); 1,175(1,4); 1,157(0,7); 1,051(0,5); 1,034(0,9); 1,020(1,1); 1,004(1,0); 1,001(1,0); 0,990(0,8); 0,987(0,8); 0,970(0,5); 0,146(0,4); 0,008(3,7); 0,000(84,3); -0,008(4,3); -0,150(0,4)</math></p>
35	<p>Beispiel Ic-81: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,815(6,0); 8,603(1,7); 8,598(1,8); 8,569(6,6); 8,316(0,7); 7,789(8,6); 7,770(2,8); 7,764(1,8); 7,569(2,9); 7,548(2,4); 4,832(0,7); 4,829(0,7); 4,824(0,8); 4,822(0,7); 4,815(0,8); 4,807(0,7); 4,673(0,7); 4,668(0,8); 4,659(0,8); 4,656(0,8); 4,651(0,7); 4,038(0,6); 4,020(0,6); 3,838(0,5); 3,820(16,0); 3,324(38,9); 3,300(0,5); 3,249(0,3); 3,238(0,6); 3,226(0,6); 3,224(0,6); 3,213(0,8); 3,199(0,8); 3,188(0,6); 3,174(0,6); 3,163(0,3); 2,675(0,4); 2,671(0,5); 2,667(0,3); 2,506(55,1); 2,502(70,3); 2,497(51,1); 2,333(0,3); 2,329(0,4); 2,324(0,3); 1,989(2,6); 1,472(0,4); 1,464(0,5); 1,453(0,6); 1,445(0,8); 1,439(0,6); 1,428(0,5); 1,420(0,6); 1,412(0,6); 1,404(0,7); 1,398(2,2); 1,393(0,8); 1,387(0,8); 1,379(0,6); 1,368(0,5); 1,359(0,5); 1,193(0,7); 1,175(1,4); 1,157(0,7); 1,051(0,5); 1,034(0,9); 1,020(1,1); 1,004(1,0); 1,001(1,0); 0,990(0,8); 0,987(0,8); 0,970(0,5); 0,146(0,4); 0,008(3,7); 0,000(84,3); -0,008(4,3); -0,150(0,4)</math></p>
40	<p>Beispiel Ic-96: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,837(3,3); 8,798(0,9); 8,580(3,5); 8,530(0,9); 7,927(0,6); 7,856(0,3); 7,834(1,2); 7,829(1,3); 7,808(1,9); 7,802(2,7); 7,678(0,5); 7,657(0,4); 7,627(1,9); 7,606(1,6); 3,821(16,0); 3,327(74,0); 3,126(2,5); 2,867(10,1); 2,672(0,4); 2,511(22,7); 2,507(45,9); 2,503(60,9); 2,498(44,5); 2,494(21,8); 2,329(0,4); 1,705(2,0); 1,701(2,2); 1,478(1,1); 1,398(8,9); 0,000(5,3)</math></p>
45	<p>Beispiel Ic-98: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)</math>:  <math>\delta = 19,976(0,4); 9,362(1,6); 8,419(0,4); 8,291(5,3); 8,225(5,3); 8,177(0,9); 8,163(0,9); 7,923(4,0); 7,751(3,6); 7,745(3,6); 7,714(2,7); 7,694(3,0); 7,688(3,2); 7,656(1,4); 7,634(1,0); 7,618(0,7); 7,588(0,9); 7,572(0,6); 7,551(0,5); 7,534(0,5); 7,520(3,4); 7,500(2,7); 7,487(0,6); 7,394(0,6); 7,202(0,8); 7,183(1,3); 7,161(0,6); 6,136(0,5); 5,985(1,5); 5,886(0,4); 4,192(1,0); 4,085(0,9); 4,068(2,6); 4,050(2,7); 4,032(1,0); 3,894(1,1); 3,862(2,8); 3,809(0,5); 3,785(16,0); 2,889(0,4);</math></p>
50	<p><math>2,567(0,5); 2,550(0,5); 2,530(0,4); 2,468(3,2); 2,464(4,1); 2,459(2,7); 2,348(0,5); 2,243(1,1); 2,161(1572,6); 2,139(30,6); 2,120(5,8); 2,114(6,6); 2,108(7,6); 2,102(5,3); 2,096(3,0); 1,972(19,3); 1,965(45,5); 1,953(475,0); 1,947(832,2); 1,941(1075,4); 1,934(736,8); 1,928(381,7); 1,781(2,7); 1,775(4,8); 1,769(6,3); 1,763(4,3); 1,757(2,3); 1,602(1,9); 1,588(5,2); 1,582(5,7); 1,568(2,7); 1,528(0,5); 1,407(0,4); 1,367(2,6); 1,354(5,3); 1,346(5,4); 1,332(1,9); 1,272(0,6); 1,249(0,5); 1,234(0,4); 1,222(3,1); 1,204(6,2); 1,186(3,0); 1,034(0,4); 0,984(0,5); 0,965(1,0); 0,948(0,5); 0,146(3,7); 0,000(819,7); -0,009(37,8); -0,028(5,4); -0,075(0,4); -0,092(0,4); -0,150(4,0)</math></p>
55	<p>Beispiel Ic-99: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)</math>:</p>

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 8,307(3,6); 8,225(3,4); 8,197(0,5); 8,137(0,6); 7,930(2,6); 7,757(0,4); 7,752(0,5); 7,741(2,2); 7,735(2,8); 7,726(0,6); 7,723(0,4); 7,709(1,6); 7,703(1,1); 7,699(0,5); 7,688(1,6); 7,682(1,3); 7,678(0,4); 7,608(0,4); 7,585(0,9); 7,571(0,6); 7,550(0,3); 7,515(2,5); 7,494(2,0); 7,391(0,4); 3,861(1,8); 3,800(10,5); 3,760(16,0); 3,513(2,7); 2,146(62,9); 2,120(0,4); 2,114(0,6); 2,108(0,7); 2,101(0,5); 1,972(0,7); 1,964(3,7); 1,958(8,9); 1,952(42,4); 1,946(76,1); 1,940(100,5); 1,934(68,4); 1,928(34,8); 1,775(0,4); 1,769(0,6); 1,762(0,4); 1,603(1,2); 1,589(3,1); 1,582(3,4); 1,569(1,6); 1,400(0,3); 1,360(1,6); 1,346(3,3); 1,339(2,9); 1,325(1,4); 0,932(0,3); 0,913(0,8); 0,894(0,5); 0,891(0,5); 0,146(0,4); 0,008(3,8); 0,000(100,3); -0,009(3,6); -0,150(0,4)$

10

Beispiel Ic-100:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,253(5,9); 8,244(5,4); 8,156(0,7); 8,143(0,7); 7,691(4,5); 7,686(4,2); 7,676(1,1); 7,671(0,6); 7,658(2,4); 7,652(1,8); 7,637(2,3); 7,631(1,9); 7,528(1,3); 7,507(1,0); 7,493(3,5); 7,472(2,7); 7,236(0,5); 7,213(0,5); 6,924(1,3); 6,836(1,7); 6,831(0,7); 6,818(0,6); 6,811(0,3); 6,732(1,0); 4,067(0,7); 4,050(0,7); 3,803(16,0); 2,875(0,7); 2,866(1,1); 2,858(1,6); 2,848(1,6); 2,840(1,2); 2,830(0,9); 2,820(0,5); 2,802(0,4); 2,793(0,4); 2,671(0,7); 2,662(1,1); 2,653(1,5); 2,644(1,4); 2,635(1,0); 2,626(0,7); 2,253(0,4); 2,154(253,3); 2,120(1,3); 2,114(1,3); 2,108(1,5); 2,101(1,1); 2,095(0,6); 1,972(4,5); 1,964(7,7); 1,952(84,3); 1,946(147,1); 1,940(189,4); 1,934(130,4); 1,928(66,1); 1,780(0,4); 1,775(0,8); 1,769(1,1); 1,762(0,7); 1,756(0,3); 1,437(1,5); 1,372(0,3); 1,340(1,1); 1,285(1,7); 1,271(2,6); 1,243(0,7); 1,222(0,9); 1,204(1,7); 1,186(0,8); 0,881(0,4); 0,801(0,8); 0,788(2,7); 0,784(3,5); 0,771(3,7); 0,764(3,2); 0,754(1,7); 0,747(1,1); 0,734(0,8); 0,659(1,2); 0,646(3,3); 0,642(3,5); 0,629(3,5); 0,624(2,7); 0,616(1,9); 0,605(4,3); 0,599(4,3); 0,590(3,7); 0,577(1,1); 0,562(0,7); 0,556(0,7); 0,547(0,6); 0,314(1,3); 0,302(3,1); 0,296(3,2); 0,292(3,1); 0,288(2,9); 0,275(0,9); 0,146(1,3); 0,000(277,3); -0,008(13,9); -0,150(1,4)$

15

20

Beispiel Ic-101:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,270(5,6); 8,254(5,4); 7,756(0,6); 7,750(0,9); 7,741(3,2); 7,736(4,3); 7,715(0,6); 7,708(2,3); 7,702(1,6); 7,687(2,4); 7,682(2,0); 7,641(1,3); 7,570(0,7); 7,549(0,5); 7,525(3,5); 7,504(2,8); 6,754(0,9); 3,807(16,0); 2,672(0,6); 2,664(1,0); 2,655(1,4); 2,645(1,4); 2,637(1,0); 2,627(0,6); 2,166(149,2); 2,120(0,4); 2,114(0,6); 2,108(0,7); 2,102(0,5); 1,972(1,7); 1,965(3,3); 1,959(8,1);$

25

30

$1,953(40,0); 1,947(71,9); 1,941(95,7); 1,934(66,1); 1,928(34,6); 1,775(0,4); 1,769(0,6); 1,763(0,4); 1,605(1,6); 1,590(4,2); 1,584(4,8); 1,570(2,2); 1,563(0,6); 1,365(2,3); 1,352(4,6); 1,345(4,8); 1,330(1,8); 1,285(0,4); 1,270(0,7); 1,221(0,4); 1,204(0,6); 1,186(0,3); 0,661(0,8); 0,648(2,5); 0,643(3,1); 0,630(3,2); 0,626(2,5); 0,613(0,9); 0,317(0,9); 0,304(2,7); 0,299(2,9); 0,295(2,7); 0,290(2,7); 0,277(0,8); 0,146(0,6); 0,008(5,4); 0,000(133,8); -0,009(6,5); -0,150(0,6)$

35

Beispiel Ic-102:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 9,802(3,8); 8,415(5,3); 8,296(5,1); 7,771(2,9); 7,765(3,5); 7,734(1,9); 7,728(1,4); 7,713(2,2); 7,707(1,8); 7,585(1,3); 7,534(3,4); 7,513(2,7); 4,068(0,4); 4,050(0,4); 3,895(16,0); 3,794(1,7); 3,758(1,9); 3,412(1,8); 2,146(110,9); 2,142(147,6); 2,120(1,0); 2,114(1,1); 2,108(1,3); 2,101(0,9); 2,095(0,5); 1,972(2,7); 1,964(7,2); 1,958(16,7); 1,952(78,0); 1,946(137,5); 1,940(181,3); 1,934(123,5); 1,928(63,0); 1,781(0,5); 1,775(0,8); 1,769(1,0); 1,762(0,7); 1,756(0,4); 1,606(1,4); 1,592(3,7); 1,585(3,6); 1,571(1,9); 1,437(0,8); 1,365(1,9); 1,352(3,6); 1,345(3,8); 1,330(1,4); 1,285(0,3); 1,270(0,6); 1,221(0,4); 1,204(0,9); 1,186(0,4); 1,135(0,8); 0,146(0,6); 0,008(6,7); 0,000(144,1); -0,009(5,4); -0,150(0,7)$

40

Beispiel Ic-103:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,255(5,8); 8,224(6,0); 7,711(3,5); 7,706(4,3); 7,694(0,3); 7,675(2,2); 7,669(1,6); 7,654(2,5); 7,649(2,1); 7,492(4,0); 7,471(3,2); 6,929(0,9); 5,325(5,1); 5,203(5,1); 4,085(0,5); 4,067(1,4); 4,050(1,4); 4,032(0,5); 3,832(16,0); 2,874(0,7); 2,865(1,0); 2,856(1,6); 2,846(1,6); 2,838(1,1); 2,828(0,8); 2,153(53,1); 2,120(0,4); 2,114(0,5); 2,108(0,5); 2,102(0,4); 1,972(6,0); 1,965(2,3); 1,958(5,7); 1,953(27,9); 1,947(50,1); 1,941(66,5); 1,934(45,6); 1,928(23,4); 1,775(0,3); 1,769(0,4); 1,285(0,4); 1,271(1,2); 1,221(1,7); 1,204(3,2); 1,186(1,6); 0,800(0,9); 0,787(2,8); 0,782(3,6); 0,770(3,7); 0,764(2,7); 0,752(1,2); 0,615(1,2); 0,604(3,1); 0,598(3,3); 0,593(2,9); 0,588(2,9); 0,576(0,9); 0,008(1,2); 0,000(31,7); -0,008(1,3)$

50

Beispiel Ic-104:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

55

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5	<p><math>\delta = 8,303(5,5); 8,236(5,2); 7,756(3,3); 7,750(4,0); 7,718(2,1); 7,713(1,7); 7,698(2,4); 7,692(2,1); 7,637(1,2); 7,521(3,7); 7,500(3,1); 7,447(0,5); 7,236(0,3); 6,869(0,3); 4,416(4,5); 4,403(4,6); 4,085(1,2); 4,068(3,7); 4,050(3,7); 4,032(1,3); 3,809(16,0); 3,325(0,8); 3,316(1,0); 2,445(0,4); 2,162(75,4); 2,114(0,4); 2,108(0,5); 2,102(0,4); 1,972(16,3); 1,965(2,8); 1,959(6,0); 1,953(30,6); 1,947(55,3); 1,941(73,7); 1,934(50,7); 1,928(26,1); 1,775(0,3); 1,769(0,5); 1,763(0,3); 1,603(1,6); 1,589(4,1); 1,582(4,1); 1,568(2,2); 1,528(0,4); 1,478(0,4); 1,372(4,7); 1,364(2,5); 1,350(4,2); 1,343(5,6); 1,340(6,8); 1,329(1,8); 1,311(0,4); 1,304(0,4); 1,285(6,8); 1,277(5,8); 1,269(1,5); 1,221(4,5); 1,204(8,7); 1,186(4,4); 0,008(1,3); 0,000(36,4); -0,009(1,4)</math></p>
10	<p>Beispiel Ic-108: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,904(1,1); 8,886(1,2); 8,840(3,8); 8,591(4,1); 7,788(4,8); 7,783(2,1); 7,771(1,9); 7,765(1,4);</math></p>
15	<p><math>7,572(1,9); 7,566(0,8); 7,554(0,5); 7,549(1,7); 4,578(0,4); 4,559(0,7); 4,540(0,7); 4,522(0,4); 4,056(0,8); 4,039(2,4); 4,021(2,5); 4,003(0,9); 3,825(9,8); 3,426(0,4); 3,417(0,6); 3,407(0,7); 3,397(0,6); 3,386(0,4); 3,332(14,8); 2,525(0,3); 2,512(6,4); 2,508(12,7); 2,503(16,4); 2,499(11,7); 2,494(5,6); 2,457(0,5); 2,451(0,3); 2,436(0,8); 2,431(0,8); 2,424(0,9); 2,419(0,8); 2,411(0,8); 2,406(1,1); 2,386(0,7); 2,287(0,7); 2,277(0,8); 2,267(0,9); 2,256(1,1); 2,244(0,7); 2,234(0,6); 2,224(0,5); 2,042(16,0); 2,032(1,9); 1,990(10,4); 1,236(1,2); 1,193(2,8); 1,176(5,5); 1,158(2,7); 0,000(3,8)</math></p>
20	<p>Beispiel Ic-109: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,998(0,7); 8,984(1,2); 8,970(0,6); 8,840(3,3); 8,583(3,5); 8,317(0,6); 7,801(1,0); 7,796(1,2); 7,781(1,0); 7,775(2,0); 7,768(2,8); 7,764(1,6); 7,578(2,1); 7,557(1,7); 4,065(2,0); 4,059(2,1); 4,051(2,1); 4,045(1,9); 3,823(8,9); 3,328(186,6); 3,185(1,1); 3,179(2,2); 3,173(1,0); 2,675(1,3); 2,671(1,6); 2,666(1,2); 2,506(205,9); 2,502(250,6); 2,497(178,5); 2,333(1,3); 2,329(1,6); 2,324(1,2); 1,989(0,4); 1,398(16,0); 1,235(1,1); 0,000(6,2)</math></p>
25	<p>Beispiel Ic-110: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 9,134(1,1); 9,112(1,1); 8,847(3,3); 8,585(3,6); 8,317(0,5); 7,829(0,9); 7,823(1,0); 7,808(1,1); 7,802(1,3); 7,751(2,2); 7,746(1,9); 7,603(2,2); 7,582(1,9); 4,804(0,5); 4,784(0,5); 3,821(8,5); 3,328(134,0); 2,676(0,8); 2,671(1,1); 2,667(0,8); 2,541(0,5); 2,524(2,9); 2,511(65,4); 2,507(132,6); 2,502(173,7); 2,498(124,3); 2,494(59,5); 2,333(0,8); 2,329(1,1); 2,324(0,8); 1,398(16,0); 1,343(4,1); 1,326(4,0); 1,236(1,2); 0,000(6,7)</math></p>
30	<p>Beispiel Ic-111: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,813(5,9); 8,761(1,0); 8,746(2,0); 8,732(1,0); 8,562(6,5); 7,788(1,5); 7,783(2,4); 7,770(3,6); 7,765(9,2); 7,568(3,3); 7,563(1,1); 7,551(1,0); 7,545(2,7); 5,333(0,4); 5,317(1,5); 5,301(2,4); 5,285(1,6); 5,269(0,5); 4,954(1,9); 4,946(4,2); 4,938(3,5); 4,930(3,8); 4,922(1,8); 4,038(0,6); 4,020(0,6); 3,885(0,9); 3,877(1,8); 3,870(2,4); 3,862(3,2); 3,855(2,4); 3,848(1,8); 3,839(1,1); 3,825(16,0); 3,330(47,7); 2,891(0,5); 2,732(0,5); 2,672(0,3); 2,511(21,8); 2,507(43,0); 2,503(55,5); 2,498(39,6); 2,494(18,8); 2,329(0,3); 1,989(2,5); 1,236(2,7); 1,193(0,7); 1,175(1,4); 1,157(0,7); 0,000(1,6)</math></p>
35	<p>Beispiel Ic-112: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,835(4,0); 8,829(3,3); 8,809(0,5); 8,795(0,6); 8,781(1,1); 8,766(0,6); 8,590(3,8); 8,579(3,2); 7,813(2,6); 7,808(3,8); 7,796(2,7); 7,790(1,4); 7,775(2,8); 7,769(2,1); 7,576(4,2); 7,556(3,6); 6,503(0,6); 6,499(1,3); 6,495(0,6); 6,470(0,7); 6,466(1,5); 6,462(0,8); 6,458(0,6); 6,453(1,1); 6,449(0,5); 6,440(0,6); 6,436(1,2); 6,431(0,6); 6,071(0,6); 6,056(1,3); 6,040(0,7); 6,022(1,5); 6,006(1,6); 5,989(1,2); 5,973(0,5); 4,055(1,0); 4,050(0,9); 4,037(1,8); 4,026(0,9); 4,021(1,2); 3,934(1,0); 3,931(1,1); 3,920(1,9); 3,916(1,9); 3,905(1,1); 3,901(1,0); 3,824(16,0); 3,329(94,9);</math></p>
40	<p><math>2,676(0,4); 2,671(0,6); 2,667(0,4); 2,525(1,5); 2,511(36,2); 2,507(72,1); 2,502(93,4); 2,498(65,7); 2,493(30,4); 2,334(0,5); 2,329(0,6); 2,325(0,4); 1,989(2,3); 1,235(2,9); 1,193(0,6); 1,175(1,2); 1,157(0,6); 0,000(5,2)</math></p>
45	<p>Beispiel Ic-113: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,834(4,9); 8,580(5,4); 8,383(1,5); 8,364(1,5); 7,770(1,4); 7,765(1,7); 7,750(1,5); 7,744(2,3); 7,727(3,7); 7,722(2,6); 7,551(3,4); 7,530(2,8); 4,074(0,6); 4,056(1,1); 4,038(1,6); 4,020(1,1); 4,002(0,4); 3,822(12,9); 3,329(78,9); 2,676(0,4); 2,671(0,6); 2,667(0,4); 2,524(1,5); 2,511(36,1); 2,507(71,1); 2,502(91,6); 2,498(65,5); 2,494(31,3); 2,334(0,4); 2,329(0,6); 2,325(0,4); 1,989(3,3); 1,236(1,7); 1,193(1,0); 1,171(16,0); 1,154(15,8); 1,068(0,5); 0,000(3,6)</math></p>
50	<p>Beispiel Ic-114: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)</math>:</p>
55	

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 8,262(11,5); 7,714(3,0); 7,709(3,7); 7,678(2,0); 7,673(1,5); 7,658(2,3); 7,652(1,9); 7,498(3,5); 7,477(2,7); 6,952(0,9); 4,563(9,6); 4,085(0,5); 4,068(1,3); 4,050(1,3); 4,032(0,5); 3,823(0,7); 3,802(16,0); 3,067(1,0); 2,877(0,7); 2,868(0,9); 2,859(1,4); 2,849(1,5); 2,840(1,0); 2,831(0,7); 2,469(1,1); 2,465(1,5); 2,460(1,0); 2,456(0,6); 2,165(519,2); 2,120(1,3); 2,114(1,9); 2,108(2,3); 2,102(1,6); 2,096(0,9); 1,972(8,1); 1,965(14,4); 1,959(35,3); 1,953(157,2); 1,947(275,4); 1,941(360,5); 1,934(245,6); 1,928(124,7); 1,781(0,9); 1,775(1,6); 1,769(2,1); 1,763(1,4); 1,757(0,7); 1,271(0,4); 1,222(1,5); 1,204(3,0); 1,186(1,5); 1,168(2,0); 0,801(0,7); 0,788(2,5); 0,783(3,1); 0,770(3,3); 0,765(2,4); 0,753(1,1); 0,616(1,1); 0,605(2,9); 0,598(3,0); 0,589(2,5); 0,576(0,8); 0,146(1,5); 0,008(15,1); 0,000(325,6); -0,009(12,8); -0,150(1,5)$

10

Beispiel Ic-115:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

15

$\delta = 8,266(4,8); 8,239(5,2); 7,763(3,0); 7,757(3,6); 7,726(1,9); 7,720(1,4); 7,705(2,2); 7,699(1,8); 7,575(1,3); 7,525(3,4); 7,504(2,8); 5,328(4,1); 5,206(4,1); 4,085(0,3); 4,067(1,0); 4,050(1,0); 4,032(0,3); 3,835(13,5); 2,139(40,9); 2,120(0,4); 2,114(0,5); 2,108(0,6); 2,101(0,4); 1,972(4,5); 1,964(2,9); 1,958(7,6); 1,953(36,3); 1,946(64,9); 1,940(85,2); 1,934(57,8); 1,928(29,2); 1,775(0,4); 1,769(0,5); 1,763(0,3); 1,605(1,5); 1,591(3,8); 1,584(3,7); 1,570(1,9); 1,437(16,0); 1,364(2,0); 1,350(3,8); 1,344(3,8); 1,329(1,5); 1,222(1,2); 1,204(2,3); 1,186(1,1); 0,146(0,4); 0,008(4,2); 0,000(101,9); -0,009(3,6); -0,150(0,5)$

20

Beispiel Ic-116:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

25

$\delta = 8,278(5,6); 8,254(5,3); 7,756(3,3); 7,751(3,9); 7,699(1,9); 7,694(1,6); 7,678(2,3); 7,673(2,1); 7,520(3,9); 7,500(3,8); 7,484(0,9); 4,510(0,6); 4,503(0,4); 4,491(0,6); 4,484(1,2); 4,477(0,3); 4,472(0,3); 4,465(1,3); 4,458(0,7); 4,446(0,5); 4,439(0,7); 4,139(0,5); 4,133(1,9); 4,125(1,6); 4,121(0,7); 4,114(1,9); 4,110(2,0); 4,106(1,9); 4,102(2,3); 4,095(0,8); 4,091(1,5); 4,083(1,9); 4,077(0,6); 3,755(16,0); 3,256(0,6); 3,250(1,9); 3,242(1,4); 3,224(2,5); 3,219(2,5); 3,201(1,3); 3,193(1,8); 3,188(0,6); 2,166(14,4); 1,972(0,6); 1,965(0,6); 1,958(1,4); 1,953(7,4); 1,947(13,4);$

$1,940(18,0); 1,934(12,6); 1,928(6,7); 0,008(1,2); 0,000(30,8); -0,008(1,6)$

30

Beispiel Ic-117:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

35

$\delta = 8,271(5,7); 8,247(5,3); 7,769(3,5); 7,763(3,9); 7,710(2,0); 7,705(1,7); 7,689(2,7); 7,684(2,7); 7,528(3,7); 7,507(3,0); 4,686(0,4); 4,674(0,5); 4,664(1,0); 4,654(0,7); 4,650(1,0); 4,642(0,9); 4,635(0,4); 4,628(0,8); 4,616(0,4); 4,571(2,1); 4,565(0,9); 4,552(0,9); 4,548(1,3); 4,543(1,3); 4,535(2,6); 4,529(0,5); 4,522(0,7); 4,514(1,7); 4,200(2,5); 4,188(2,7); 4,184(1,1); 4,171(0,8); 4,163(2,0); 4,151(2,0); 4,067(0,4); 4,049(0,4); 3,754(16,0); 2,163(24,4); 1,972(1,9); 1,964(0,8); 1,953(9,1); 1,946(16,3); 1,940(21,6); 1,934(15,0); 1,928(7,9); 1,436(0,5); 1,270(0,6); 1,221(0,5); 1,203(1,0); 1,186(0,5); 0,000(34,9); -0,008(1,8)$

40

Beispiel Ic-118:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,386(3,3); 8,307(3,7); 8,270(3,2); 7,912(1,5); 7,895(0,6); 7,890(2,0); 7,726(5,4); 7,721(2,0); 7,709(1,2); 7,704(0,7); 7,619(0,4); 7,026(0,6); 4,068(0,7); 4,050(0,7); 3,938(16,0); 3,900(1,6); 3,757(10,5); 2,872(0,4); 2,863(0,6); 2,854(0,9); 2,845(0,9); 2,836(0,6); 2,827(0,4); 2,135(38,8); 2,134(45,2); 2,119(0,4); 2,113(0,4); 2,107(0,5); 2,101(0,4); 1,972(3,5); 1,964(2,9); 1,958(6,8); 1,952(33,7); 1,946(60,0); 1,940(79,6); 1,933(54,4); 1,927(27,7); 1,914(0,3); 1,768(0,5); 1,270(0,4); 1,221(0,9); 1,204(1,7); 1,186(0,8); 0,794(0,5); 0,782(1,5); 0,776(2,1); 0,764(2,1); 0,759(1,6); 0,747(0,7); 0,628(0,7); 0,617(1,7); 0,610(1,9); 0,606(1,6); 0,601(1,6); 0,589(0,5); 0,146(0,6); 0,008(5,4); 0,000(125,8); -0,009(4,1); -0,150(0,6)$

45

Beispiel Ic-119:  $^1\text{H-NMR}(600,1 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

50

$\delta = 8,870(0,4); 8,856(0,4); 8,844(1,2); 8,824(1,2); 8,811(1,2); 8,791(3,7); 8,588(1,3); 8,529(4,0); 7,794(1,1); 7,791(1,6); 7,787(0,5); 7,781(1,2); 7,777(1,9); 7,773(0,6); 7,753(2,6); 7,749(2,1); 7,742(0,9); 7,738(0,7); 7,573(2,6); 7,559(2,4); 4,641(0,5); 4,629(0,8); 4,616(0,5); 4,323(0,3); 3,818(10,2); 3,680(0,6); 3,678(0,6); 3,668(0,7); 3,346(0,5); 3,325(140,9); 2,614(0,3); 2,523(0,6); 2,520(0,7); 2,517(0,8); 2,505(39,3); 2,502(52,9); 2,499(38,3); 2,496(18,1); 2,292(0,3); 2,288(0,4); 2,284(0,5); 2,279(0,6); 2,275(0,4); 2,271(0,5); 2,267(0,6); 2,251(0,4); 2,237(0,6); 2,224(0,5); 2,218(0,5); 2,206(0,5); 2,192(0,6); 2,181(0,5); 2,177(0,5); 2,165(0,7); 2,153(0,3); 2,148(0,4); 2,105(5,0); 2,030(16,0); 1,745(0,4); 1,736(0,4); 1,733(0,4); 1,728(0,6); 1,719(0,5); 1,710(0,4); 1,398(3,5); 1,236(0,7); 0,000(4,9)$

55

Beispiel Ic-120:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5	<p><math>\delta = 8,823(4,9); 8,742(2,1); 8,723(2,1); 8,573(5,0); 7,778(2,2); 7,757(2,8); 7,737(4,6); 7,562(2,8); 7,544(2,3); 7,541(2,4); 4,154(0,3); 4,132(1,2); 4,112(1,7); 4,093(1,2); 4,075(0,4); 4,052(0,7); 4,038(1,9); 4,034(1,9); 4,020(2,0); 4,017(2,0); 4,002(0,8); 3,820(14,3); 3,327(20,8); 3,323(17,5); 2,733(1,0); 2,721(1,2); 2,701(1,6); 2,690(1,8); 2,598(1,3); 2,576(2,0); 2,544(2,0); 2,499(51,1); 2,326(0,4); 2,169(0,6); 2,150(1,6); 2,129(1,6); 2,106(0,8); 2,059(15,9); 2,055(16,0); 2,052(13,8);</math></p>
10	<p><math>1,989(7,5); 1,986(7,5); 1,983(6,6); 1,907(0,5); 1,885(1,4); 1,863(1,7); 1,845(1,6); 1,830(1,6); 1,807(1,6); 1,783(1,0); 1,759(0,3); 1,456(0,4); 1,431(1,3); 1,408(1,6); 1,385(1,1); 1,234(0,9); 1,193(2,1); 1,189(2,1); 1,186(1,9); 1,175(4,1); 1,172(4,0); 1,168(3,5); 1,157(2,3); 1,154(2,1); 1,151(1,8); 0,000(11,7); -0,004(11,6); -0,007(10,0)</math></p>
15	<p>Beispiel Ic-121: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)</math>:  <math>\delta = 9,839(1,2); 8,383(1,6); 8,277(1,6); 7,757(0,9); 7,752(1,1); 7,723(0,6); 7,717(0,5); 7,702(0,7); 7,696(0,6); 7,581(0,4); 7,528(1,1); 7,507(0,9); 6,869(0,3); 3,881(4,9); 2,611(1,2); 2,139(3,2); 1,971(1,3); 1,958(0,7); 1,952(3,6); 1,946(6,5); 1,940(8,7); 1,934(5,9); 1,927(3,0); 1,603(0,5); 1,589(1,2); 1,582(1,2); 1,569(0,6); 1,365(0,6); 1,352(1,2); 1,345(1,2); 1,330(0,5); 1,221(0,3); 1,203(0,7); 1,186(0,3); 1,134(16,0); 0,008(0,6); 0,000(15,2); -0,009(0,5)</math></p>
20	<p>Beispiel Ic-122: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 9,010(0,5); 8,991(0,5); 8,950(1,6); 8,932(1,7); 8,838(5,1); 8,591(5,1); 8,585(1,9); 7,817(2,3); 7,812(3,3); 7,802(1,8); 7,796(1,0); 7,780(2,3); 7,775(2,1); 7,768(1,0); 7,583(2,8); 7,568(1,1); 7,562(2,4); 7,546(0,7); 4,560(0,5); 4,541(0,9); 4,521(0,9); 4,502(0,5); 4,056(1,3); 4,038(3,8); 4,020(3,9); 4,002(1,4); 3,895(0,5); 3,882(0,6); 3,871(0,9); 3,859(0,7); 3,846(0,6); 3,825(13,4); 3,771(0,4); 3,325(36,5); 2,967(15,0); 2,888(5,0); 2,748(0,6); 2,738(0,8); 2,727(0,8); 2,712(1,4); 2,702(1,1); 2,690(1,1); 2,680(0,9); 2,589(0,4); 2,583(0,5); 2,559(0,5); 2,540(0,4); 2,506(34,2); 2,502(43,3); 2,498(33,2); 2,476(1,8); 2,465(1,4); 2,446(0,6); 2,440(0,7); 2,363(0,6); 2,357(0,5); 2,338(0,6); 2,333(0,7); 1,989(16,0); 1,275(0,3); 1,259(0,8); 1,244(0,6); 1,193(4,2); 1,175(8,3); 1,157(4,2); 0,000(1,0)</math></p>
30	<p>Beispiel Ic-123: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,830(5,5); 8,814(2,7); 8,578(4,6); 8,565(2,2); 7,801(1,1); 7,795(1,6); 7,789(1,3); 7,783(2,4); 7,772(2,9); 7,767(5,6); 7,573(2,3); 7,562(1,5); 7,557(0,8); 7,550(2,0); 7,541(1,1); 4,273(0,3); 4,253(0,6); 4,242(0,8); 4,232(0,6); 4,222(1,1); 4,201(0,8); 4,055(0,9); 4,038(2,6); 4,020(2,7); 4,002(0,9); 3,822(16,0); 3,324(170,5); 3,011(0,4); 2,995(0,6); 2,978(0,8); 2,966(3,1); 2,951(2,1); 2,944(2,0); 2,925(0,6); 2,905(0,7); 2,892(0,3); 2,872(0,4); 2,704(0,4); 2,675(1,0); 2,671(1,2); 2,666(1,1); 2,641(0,7); 2,622(0,4); 2,540(16,1); 2,534(8,3); 2,506(105,5); 2,502(129,8); 2,497(95,8); 2,332(0,7); 2,328(0,9); 2,229(0,5); 2,208(1,2); 2,188(1,3); 2,165(0,6); 1,989(11,3); 1,955(0,8); 1,947(0,9); 1,934(2,2); 1,923(1,7); 1,911(1,6); 1,888(0,8); 1,578(0,4); 1,555(0,8); 1,533(1,0); 1,510(0,6); 1,236(2,0); 1,193(3,0); 1,175(5,8); 1,157(2,9); 0,146(0,6); 0,000(115,5); -0,150(0,6)</math></p>
40	<p>Beispiel Ic-124: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,953(1,7); 8,934(1,8); 8,744(5,1); 8,467(5,4); 8,316(0,7); 7,804(4,2); 7,779(2,0); 7,774(1,6); 7,573(3,0); 7,553(2,5); 4,915(0,9); 4,895(1,4); 4,874(0,9); 4,172(0,4); 4,151(0,9); 4,136(0,9); 4,119(0,4); 4,056(0,6); 4,038(1,8); 4,020(1,8); 4,002(0,6); 3,815(13,5); 3,322(203,0); 2,979(16,0);</math></p>
45	<p><math>2,671(2,0); 2,506(228,5); 2,502(301,1); 2,498(236,9); 2,441(0,7); 2,414(1,2); 2,391(1,1); 2,367(0,8); 2,328(2,8); 2,303(0,9); 2,292(1,1); 2,279(0,8); 2,267(1,1); 2,247(1,2); 2,225(1,0); 2,217(0,7); 2,204(0,4); 2,194(0,5); 1,989(7,5); 1,298(0,7); 1,259(0,9); 1,235(0,9); 1,193(2,0); 1,175(4,0); 1,157(2,0); 0,146(1,3); 0,008(11,0); 0,000(273,4); -0,150(1,3)</math></p>
50	<p>Beispiel Ic-125: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 9,081(1,2); 9,060(1,3); 8,953(0,9); 8,935(0,9); 8,794(2,7); 8,731(3,7); 8,528(2,9); 8,453(4,0); 7,987(2,2); 7,982(2,3); 7,794(3,3); 7,789(1,7); 7,781(1,6); 7,777(2,3); 7,761(1,5); 7,755(1,4); 7,574(1,5); 7,557(2,8); 7,551(1,5); 7,536(2,0); 4,968(0,6); 4,949(0,9); 4,928(0,6); 4,801(0,4); 4,783(0,6); 4,763(0,4); 4,056(1,3); 4,038(3,8); 4,021(3,8); 4,003(1,3); 3,818(14,9); 3,664(0,8); 3,647(1,1); 3,636(0,9); 3,326(21,9); 2,561(11,9); 2,506(37,1); 2,502(47,0); 2,468(0,7); 2,442(0,4); 2,415(9,1); 2,364(0,5); 2,353(0,6); 2,331(1,0); 2,325(0,9); 2,319(0,8); 2,314(0,9); 2,292(0,9); 2,281(0,5); 2,268(0,8); 2,240(0,8); 2,235(0,7); 2,221(0,7); 2,204(0,7); 2,193(0,7); 2,173(1,0); 2,151(1,0); 2,130(0,5); 1,989(16,0); 1,875(0,5); 1,863(0,4); 1,852(0,6); 1,299(0,4); 1,259(0,5); 1,193(4,4); 1,175(8,8); 1,157(4,3); 0,008(2,4); 0,000(48,9); -0,009(2,4)</math></p>
55	<p>Beispiel Ic-126: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)</math>:</p>

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 8,261(5,3); 8,244(0,8); 8,235(4,9); 7,701(3,3); 7,696(4,1); 7,683(0,6); 7,666(2,5); 7,660(1,9); 7,645(2,9); 7,639(2,3); 7,584(0,6); 7,493(3,8); 7,472(3,0); 6,903(0,9); 4,140(0,9); 4,068(0,4); 4,050(0,4); 3,760(16,0); 3,746(1,2); 2,882(0,4); 2,873(0,9); 2,863(1,2); 2,855(1,7); 2,845(1,7); 2,836(1,0); 2,827(0,9); 2,818(0,4); 2,614(0,5); 2,467(0,4); 2,448(0,3); 2,139(489,2); 2,123(40,4); 2,114(16,3); 2,107(10,9); 2,101(6,1); 2,095(3,3); 1,964(56,6); 1,958(101,0); 1,952(373,8); 1,946(646,9); 1,940(854,8); 1,934(602,7); 1,927(335,8); 1,780(1,9); 1,774(3,5); 1,768(4,8); 1,762(3,3); 1,756(1,8); 1,437(0,6); 1,285(0,4); 1,271(0,8); 1,222(0,4); 1,204(0,9); 1,186(0,5); 1,135(7,6); 0,799(0,9); 0,787(2,6); 0,781(3,4); 0,769(3,6); 0,763(2,6); 0,751(1,5); 0,613(1,2); 0,601(2,9); 0,596(3,1); 0,592(2,8); 0,586(2,7); 0,574(1,1); 0,146(9,4); 0,137(0,8); 0,008(129,3); 0,000(2345,5); -0,009(130,3); -0,014(94,8); -0,066(0,9); -0,075(0,7); -0,142(0,9); -0,150(9,4)$

10

Beispiel Ic-127:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 19,989(0,5); 8,273(5,2); 8,250(4,8); 7,750(3,0); 7,745(3,8); 7,716(2,0); 7,710(1,6); 7,695(2,2); 7,689(1,9); 7,585(1,7); 7,525(3,5); 7,504(2,8); 4,813(1,0); 4,086(0,4); 4,068(1,0); 4,050(1,1); 4,032(0,4); 3,762(16,0); 2,596(0,6); 2,463(1,7); 2,334(0,5); 2,145(1113,7); 2,120(7,4); 2,113(8,4); 2,107(9,6); 2,101(6,6); 2,095(3,8); 1,971(10,0); 1,964(44,6); 1,958(113,6); 1,952(549,2); 1,946(983,1); 1,940(1305,2); 1,934(901,0); 1,927(463,8); 1,780(3,0); 1,774(5,6); 1,768(7,5); 1,762(5,2); 1,756(2,7); 1,602(1,6); 1,587(4,1); 1,581(4,1); 1,567(2,1); 1,363(2,2); 1,348(4,0); 1,342(4,3); 1,327(1,6); 1,269(0,8); 1,222(1,2); 1,204(2,6); 1,186(1,3); 1,135(2,7); 0,146(16,7); 0,008(156,8); 0,000(3428,8); -0,008(157,6); -0,047(1,5); -0,150(16,6)$

15

20

Beispiel Ic-128:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 10,225(0,4); 8,295(5,5); 8,275(5,1); 7,935(3,5); 7,930(3,7); 7,788(2,0); 7,783(1,8); 7,767(2,4); 7,762(2,3); 7,600(3,8); 7,579(3,1); 6,716(3,6); 6,714(3,5); 5,447(0,3); 4,068(0,5); 4,050(0,5); 3,757(16,0); 2,307(15,3); 2,305(15,1); 2,296(0,7); 2,134(62,3); 2,120(0,7); 2,113(0,8); 2,107(1,0); 2,101(0,7); 2,095(0,3); 1,972(2,9); 1,964(4,9); 1,958(11,6); 1,952(62,2); 1,946(113,0); 1,940(151,7); 1,934(103,3); 1,927(52,5); 1,914(0,6); 1,780(0,3); 1,774(0,6); 1,768(0,9); 1,762(0,6); 1,437(5,0); 1,285(0,4); 1,270(1,5); 1,222(0,7); 1,204(1,3); 1,186(0,7); 0,146(1,9); 0,024(0,4); 0,019(0,7); 0,008(15,5); 0,000(439,3); -0,009(15,0); -0,150(1,9)$

25

30

Beispiel Ic-129:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 9,241(4,1); 8,753(5,8); 8,517(6,3); 7,710(1,6); 7,706(1,8); 7,691(1,7); 7,686(2,1); 7,660(3,7); 7,656(3,0); 7,343(2,6); 7,323(2,3); 4,056(0,9); 4,038(2,8); 4,020(2,8); 4,003(1,0); 3,930(2,5); 3,813(14,8); 3,326(63,0); 2,507(33,7); 2,502(43,6); 2,498(32,3); 2,338(13,6); 1,989(12,1); 1,591(1,5); 1,577(3,7); 1,570(3,9); 1,557(1,7); 1,294(1,8); 1,281(3,7); 1,274(3,9); 1,260(1,4); 1,193(3,2); 1,175(6,4); 1,158(3,2); 1,069(16,0); 0,008(0,5); 0,000(10,7); -0,008(0,4)$

35

40

Beispiel Ic-130:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 8,729(6,2); 8,501(6,7); 8,357(2,1); 8,346(2,0); 8,316(1,3); 7,648(1,9); 7,644(2,0); 7,629(1,9); 7,624(2,2); 7,594(4,0); 7,589(3,2); 7,297(2,9); 7,277(2,5); 4,038(0,7); 4,020(0,7); 4,002(0,4); 3,930(0,4); 3,813(16,0); 3,739(0,5); 3,424(0,4); 3,405(0,4); 3,348(2,4); 3,324(578,9); 2,862(0,7); 2,853(0,9); 2,844(1,4); 2,834(1,4); 2,825(1,0); 2,816(0,7); 2,805(0,3); 2,675(2,6); 2,671(3,5); 2,666(2,6); 2,524(11,1); 2,510(198,0); 2,506(385,4); 2,502(500,9); 2,497(365,3); 2,493(177,0); 2,359(0,4); 2,349(0,6); 2,333(2,8); 2,328(4,0); 2,318(15,7); 1,989(3,0); 1,298(0,4); 1,286(0,6); 1,271(0,8); 1,259(0,9); 1,249(0,7); 1,235(0,7); 1,205(0,3); 1,193(1,0); 1,175(1,7); 1,157(0,9); 1,068(2,2); 0,716(0,8); 0,704(2,5); 0,698(3,5); 0,686(3,3); 0,680(2,8); 0,669(1,2); 0,556(1,2); 0,545(3,6); 0,539(3,2); 0,536(3,0); 0,530(2,8); 0,518(0,9); 0,146(0,6); 0,008(4,8); 0,000(136,1); -0,009(5,4); -0,150(0,6)$

45

50

Beispiel Ic-131:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 10,437(2,9); 8,783(4,5); 8,613(4,0); 8,557(5,0); 8,372(4,3); 7,819(2,6); 7,815(2,9); 7,802(1,9); 7,790(2,1); 7,785(1,5); 7,780(2,2); 7,767(2,1); 7,742(1,4); 7,738(1,3); 7,723(1,5); 7,718(1,5); 7,389(2,0); 7,369(1,8); 7,217(2,0); 7,195(3,7); 7,178(0,8); 7,173(1,9); 4,057(1,2); 4,039(3,8); 4,021(3,8); 4,003(1,3); 3,824(12,5); 3,812(10,3); 3,326(37,4); 2,511(16,0); 2,507(31,6); 2,503(41,6); 2,498(31,1); 2,494(15,8); 2,393(10,3); 1,989(16,0); 1,193(4,3); 1,176(8,5); 1,158(4,2); 0,008(0,5); 0,000(12,2); -0,008(0,5)$

Beispiel Ic-132:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,729(0,6); 8,264(0,3); 8,250(5,6); 8,228(5,2); 7,649(3,3); 7,643(4,1); 7,608(2,4); 7,602(1,7);$

55

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

7,587(2,7); 7,581(2,3); 7,457(4,1); 7,437(3,1); 4,050(0,3); 3,746(16,0); 3,429(0,5); 3,421(0,6); 3,416(0,6);  
3,411(1,0); 3,408(0,7); 3,401(0,7); 3,398(1,0); 3,392(0,6); 3,388(0,6); 3,380(0,5); 2,463(0,3); 2,169(89,4);  
2,114(0,4); 2,108(0,5); 2,102(0,3); 1,972(1,7); 1,965(2,6); 1,959(6,1); 1,953(32,8); 1,947(59,0); 1,940(79,1);  
1,934(54,3); 1,928(27,8); 1,775(0,3); 1,769(0,5); 1,437(0,3); 1,269(0,4); 1,222(0,4); 1,204(0,8); 1,186(0,4);  
0,954(0,7); 0,941(2,2); 0,936(3,0); 0,923(3,2); 0,918(2,2); 0,905(1,0); 0,785(1,1); 0,773(2,6); 0,767(2,7);  
0,763(2,3); 0,757(2,3); 0,745(0,7); 0,146(0,7); 0,008(5,8); 0,000(161,4); -0,009(5,6); -0,150(0,7)

10

Beispiel Ic-133: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):  
δ = 8,265(0,5); 8,252(14,8); 7,709(3,5); 7,704(4,3); 7,672(2,6); 7,667(1,8); 7,651(2,9); 7,646(2,4); 7,492(4,1);  
7,471(3,3); 6,964(0,8); 6,917(1,6); 6,783(3,2); 6,650(1,6); 3,806(16,0); 2,874(0,8); 2,864(1,0); 2,856(1,6);  
2,846(1,6); 2,838(1,0); 2,828(0,8); 2,170(33,3); 1,965(1,5); 1,959(2,8); 1,953(13,6); 1,947(24,3); 1,940(32,1);  
1,934(21,9); 1,928(11,1); 0,799(0,9); 0,786(2,7); 0,781(3,4); 0,769(3,7); 0,763(2,4); 0,751(1,2); 0,615(1,1);  
0,605(2,9); 0,603(2,7); 0,597(2,9); 0,593(2,5); 0,588(2,5); 0,576(0,8); 0,008(3,1); 0,000(75,5); -0,009(2,4)

15

Beispiel Ic-134: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):  
δ = 8,385(4,4); 8,269(4,1); 7,925(0,9); 7,755(0,5); 7,747(2,4); 7,742(2,8); 7,735(0,4); 7,713(1,7); 7,708(1,2);  
7,692(1,6); 7,687(1,3); 7,586(1,2); 7,568(0,6); 7,547(0,4); 7,522(2,6); 7,501(2,1); 6,870(0,4); 5,447(1,8);  
4,068(0,6); 4,050(0,6); 3,830(12,6); 3,772(0,8); 2,888(8,5); 2,767(16,0); 2,670(0,9); 2,137(8,2); 2,114(0,3);  
2,108(0,3); 1,972(2,8); 1,964(1,4); 1,957(3,3); 1,952(15,3); 1,946(27,0); 1,940(35,9); 1,934(24,7); 1,927(12,7);  
1,600(1,2); 1,586(3,3); 1,579(3,4); 1,565(1,6); 1,437(1,4); 1,363(1,6); 1,350(3,4); 1,343(3,4); 1,328(1,2);  
1,312(0,3); 1,305(0,4); 1,300(0,4); 1,285(0,7); 1,271(0,8); 1,221(0,7); 1,204(1,4); 1,186(0,7); 0,146(0,5);  
0,008(4,7); 0,000(95,8); -0,008(4,1); -0,149(0,5)

20

Beispiel Ic-135: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):  
δ = 8,731(0,9); 8,298(4,5); 8,271(4,2); 7,897(2,9); 7,892(3,0); 7,743(1,6); 7,738(1,4); 7,722(1,9); 7,717(1,8);  
7,702(2,4); 7,699(2,8); 7,680(3,1); 7,584(0,4); 7,573(3,2); 7,552(2,5); 7,418(2,0); 7,399(3,2); 7,378(2,0);  
7,194(1,1); 7,176(1,9); 7,157(0,8); 3,768(15,3); 2,192(0,4); 2,137(159,7); 2,120(1,5); 2,113(1,8); 2,107(2,1);  
2,101(1,5); 2,095(0,8); 1,964(10,3); 1,958(25,2); 1,952(133,0); 1,946(237,7); 1,940(317,3); 1,934(216,9);  
1,927(110,3); 1,915(1,2); 1,780(0,7); 1,774(1,3); 1,768(1,8); 1,762(1,2); 1,756(0,6); 1,437(16,0); 1,270(0,8);  
0,146(4,1); 0,037(0,5); 0,031(0,7); 0,028(0,9); 0,027(0,9); 0,008(35,2); 0,000(911,9); -0,009(31,9); -0,149(4,0)

25

30

Beispiel Ic-168: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):  
δ = 8,268(5,2); 8,245(4,9); 7,745(3,3); 7,740(3,7); 7,690(1,9); 7,685(1,5); 7,669(2,3); 7,664(2,0); 7,520(3,6);  
7,499(2,8); 7,098(0,7); 5,447(2,7); 4,647(1,7); 4,635(3,0); 4,622(1,8); 4,529(1,7);

35

4,517(3,0); 4,504(1,8); 4,068(0,7); 4,050(0,7); 3,763(16,0); 3,718(0,9); 3,705(1,9); 3,692(1,8); 3,679(0,9);  
3,650(0,9); 3,637(1,9); 3,624(1,8); 3,611(0,8); 2,135(21,9); 1,972(3,2); 1,964(1,8); 1,958(4,4); 1,952(19,7);  
1,946(35,0); 1,940(46,1); 1,934(31,9); 1,928(16,3); 1,437(0,6); 1,270(0,4); 1,221(0,8); 1,204(1,5); 1,186(0,7);  
0,146(0,6); 0,008(5,5); 0,000(111,7); -0,008(5,2); -0,150(0,5)

40

Beispiel Ic-169: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):  
δ = 8,272(5,4); 8,253(5,0); 7,746(2,9); 7,741(3,9); 7,722(2,3); 7,716(1,5); 7,701(2,6); 7,696(2,1); 7,543(3,7);  
7,522(2,9); 7,338(0,7); 6,996(0,6); 4,145(0,8); 4,129(0,9); 4,122(2,5); 4,105(2,5); 4,098(2,6); 4,081(2,5);  
4,074(1,0); 4,058(0,9); 3,763(16,0); 2,134(37,3); 2,120(0,7); 2,113(0,7); 2,107(0,8); 2,101(0,6); 1,964(3,7);  
1,958(9,3); 1,952(51,2); 1,946(92,7); 1,940(124,4); 1,934(86,0); 1,927(44,5); 1,774(0,5); 1,768(0,7); 1,762(0,5);  
1,437(0,4); 0,146(1,4); 0,008(11,5); 0,000(310,6); -0,009(12,4); -0,150(1,4)

45

Beispiel Ic-170: <sup>1</sup>H-NMR(400,0 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):  
δ = 8,268(4,8); 8,247(4,5); 7,749(3,0); 7,744(3,6); 7,707(2,0); 7,701(1,5); 7,686(2,4); 7,681(2,1); 7,532(3,6);  
7,511(2,8); 7,165(0,6); 6,192(0,4); 6,182(0,8); 6,172(0,4); 6,052(0,8); 6,042(1,7); 6,033(0,8); 5,913(0,4);  
5,903(0,9); 5,893(0,4); 3,817(0,8); 3,807(0,9); 3,801(0,8); 3,792(0,8); 3,778(1,8); 3,763(16,0); 3,753(1,8);  
3,739(0,9); 3,729(0,9); 3,724(0,9); 3,714(0,8); 2,139(52,3); 2,107(0,4); 1,972(1,5); 1,964(1,5); 1,958(3,9);  
1,952(20,6); 1,946(37,0); 1,940(49,4); 1,934(34,0); 1,928(17,5); 1,437(0,9); 1,270(0,6); 1,221(0,4); 1,204(0,7);  
1,186(0,4); 0,146(0,5); 0,008(4,4); 0,000(115,7); -0,009(4,6); -0,150(0,5)

50

Beispiel Ic-176: <sup>1</sup>H-NMR(601,6 MHz, Acetontril-d<sub>3</sub>):

55

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 8,270(5,6); 8,248(5,1); 7,738(1,2); 7,700(3,3); 7,696(4,1); 7,676(2,4); 7,672(1,8); 7,662(2,7); 7,658(2,3); 7,500(3,7); 7,487(3,1); 3,752(16,0); 3,719(1,8); 3,708(5,7); 3,696(5,7); 3,684(1,8); 2,583(0,6); 2,178(4,2); 1,967(0,3); 1,958(0,9); 1,954(1,1); 1,951(5,7); 1,946(9,9); 1,942(14,7); 1,938(10,0); 1,934(5,0); 1,268(0,4); 1,155(5,7); 1,143(12,0); 1,132(5,8); 1,118(0,3); 1,105(1,4); 1,096(3,8); 1,092(3,9); 1,084(2,1); 1,000(2,1); 0,992(3,8); 0,988(3,9); 0,979(1,4); 0,000(5,2)$

10

Beispiel Ic-177:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,260(5,2); 8,234(4,8); 7,713(3,0); 7,708(4,0); 7,681(2,0); 7,675(1,5); 7,660(2,3); 7,655(2,0); 7,502(3,5); 7,482(2,8); 6,919(0,8); 4,807(0,6); 4,802(0,6); 4,799(0,6); 4,793(0,6); 4,790(0,7); 4,785(0,6); 4,782(0,6); 4,651(0,6); 4,643(0,6); 4,637(0,6); 4,634(0,6); 4,629(0,6); 4,626(0,6); 4,068(0,5); 4,050(0,6); 3,760(16,0); 3,218(0,4); 3,215(0,3); 3,207(0,5); 3,193(0,6); 3,190(0,6); 3,182(0,6); 3,168(0,5); 3,155(0,4); 2,582(1,0); 2,464(0,3); 2,161(140,4); 2,120(0,5); 2,114(0,6); 2,108(0,8); 2,102(0,6); 1,972(2,8); 1,965(3,7); 1,959(9,2); 1,953(47,0); 1,947(84,9); 1,940(113,7); 1,934(79,6); 1,928(41,8); 1,775(0,5); 1,769(0,6); 1,763(0,5); 1,471(0,4); 1,463(0,5); 1,450(0,6); 1,437(8,0); 1,426(0,7); 1,418(0,6); 1,411(0,5); 1,403(0,5); 1,391(0,5); 1,386(0,6); 1,383(0,6);$

15

$1,378(0,5); 1,366(0,5); 1,358(0,5); 1,222(0,6); 1,204(1,2); 1,186(0,6); 1,098(0,5); 1,081(0,7); 1,078(0,6); 1,067(0,9); 1,064(0,7); 1,061(0,7); 1,055(0,7); 1,052(0,8); 1,049(0,8); 1,038(0,6); 1,035(0,7); 1,032(0,6); 1,018(0,4); 0,146(1,2); 0,008(10,6); 0,000(259,6); -0,009(12,7); -0,150(1,2)$

20

Beispiel Ic-180:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,259(5,6); 8,258(5,5); 8,231(5,1); 7,696(3,3); 7,691(4,3); 7,667(2,4); 7,661(1,7); 7,646(2,8); 7,640(2,3); 7,493(4,1); 7,472(3,2); 7,197(0,3); 6,844(0,9); 3,748(16,0); 3,725(1,2); 3,719(0,7); 3,708(1,2); 3,701(2,2); 3,690(0,5); 3,683(2,2); 3,670(0,8); 3,666(0,8); 3,652(2,2); 3,646(0,4); 3,635(2,3); 3,628(1,2); 3,617(0,8); 3,611(1,2); 3,593(0,4); 3,569(0,7); 3,556(0,8); 3,551(2,0); 3,538(2,1); 3,534(2,0); 3,520(2,0); 3,516(0,7); 3,503(0,7); 3,344(1,0); 3,340(1,0); 3,335(1,1); 3,331(1,1); 3,327(1,1); 3,323(1,1); 3,317(1,1); 3,313(1,1); 2,839(0,5); 2,835(0,6); 2,830(0,6); 2,827(1,1); 2,823(0,7); 2,818(0,9); 2,814(0,9); 2,808(0,7); 2,804(1,1); 2,801(0,6); 2,796(0,6); 2,792(0,5); 2,467(0,4); 2,455(0,6); 2,328(1,4); 2,153(14,0); 2,143(25,1); 2,114(0,4); 2,107(0,4); 1,964(1,8); 1,958(4,6); 1,952(25,4); 1,946(46,0); 1,940(61,6); 1,934(42,1); 1,928(21,4); 1,768(0,4); 1,270(0,5); 1,197(7,1); 1,188(0,5); 1,179(14,3); 1,170(0,7); 1,161(6,9); 1,153(0,3); 1,131(4,4); 1,114(8,6); 1,096(4,2); 1,080(1,0); 1,070(1,1); 1,063(1,3); 1,057(1,2); 1,053(1,3); 1,048(1,1); 1,041(1,2); 1,031(1,2); 0,893(1,4); 0,881(1,4); 0,876(2,4); 0,864(2,0); 0,859(1,3); 0,847(1,0); 0,146(0,4); 0,008(3,6); 0,000(101,9); -0,009(3,1); -0,150(0,4)$

25

30

Beispiel Ic-181:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 8,848(2,2); 8,837(2,3); 8,818(6,3); 8,571(6,9); 8,316(0,4); 7,819(3,2); 7,813(4,6); 7,802(2,7); 7,797(1,4); 7,782(2,7); 7,776(2,1); 7,581(4,3); 7,560(3,5); 3,820(16,0); 3,326(164,0); 3,253(0,5); 3,241(1,0); 3,232(1,4); 3,220(1,4); 3,211(1,0); 3,199(0,5); 2,675(0,6); 2,671(0,8); 2,666(0,6); 2,538(0,3); 2,524(2,1); 2,511(46,7); 2,506(93,9); 2,502(122,9); 2,497(88,5); 2,493(42,0); 2,333(0,6); 2,329(0,8); 2,324(0,6); 2,300(1,2); 2,056(0,4); 2,048(0,4); 2,041(0,6); 2,038(0,6); 2,032(0,8); 2,023(0,7); 2,014(0,8); 2,008(0,6); 2,005(0,6); 1,998(0,5); 1,989(0,5); 1,288(0,7); 1,272(1,7); 1,267(0,9); 1,256(1,3); 1,251(1,8); 1,236(2,0); 1,225(0,9); 1,211(1,2); 1,200(1,0); 1,187(1,1); 1,173(0,5); 0,146(0,8); 0,019(0,3); 0,018(0,3); 0,008(6,4); 0,000(178,7); -0,009(6,3); -0,150(0,7)$

35

40

Beispiel Ic-182:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 8,750(4,8); 8,523(5,1); 8,416(1,6); 8,406(1,6); 7,741(1,4); 7,736(1,5); 7,721(1,6); 7,716(1,8); 7,656(3,2); 7,651(2,8); 7,388(2,7); 7,367(2,4); 4,056(1,2); 4,038(3,7); 4,021(3,7); 4,003(1,2); 3,816(11,9); 3,327(23,3); 2,842(0,5); 2,833(0,7); 2,824(1,0); 2,814(1,0); 2,806(0,7); 2,796(0,5); 2,525(0,5); 2,511(8,9); 2,507(17,6); 2,502(23,1); 2,498(16,7); 2,493(8,0); 2,428(15,5); 1,989(16,0); 1,193(4,4); 1,175(8,6); 1,158(4,3); 0,720(0,7); 0,708(1,9); 0,702(2,6); 0,690(2,4); 0,684(2,0); 0,673(0,9); 0,568(0,9); 0,558(2,7); 0,551(2,3); 0,548(2,2); 0,542(2,0); 0,530(0,6); 0,008(1,5); 0,000(38,8); -0,009(1,5)$

45

50

Beispiel Ic-183:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

55

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 8,835(0,5); 8,819(6,2); 8,601(0,4); 8,572(6,8); 8,498(2,7); 8,488(2,7); 7,772(1,6); 7,766(2,9); 7,757(4,3); 7,752(6,6); 7,549(3,6); 7,541(1,0); 7,534(0,9); 7,526(3,0); 5,755(3,8); 3,837(1,3); 3,819(16,0); 3,686(0,3); 3,668(1,1); 3,662(0,8); 3,650(1,3); 3,644(2,1); 3,633(0,7); 3,626(2,0); 3,614(0,8); 3,609(0,8); 3,597(2,0); 3,590(0,7); 3,579(2,1); 3,572(1,3); 3,561(0,9); 3,555(1,1); 3,537(0,4); 3,324(113,0); 3,260(2,3); 3,247(1,9); 3,244(1,8); 2,671(0,5); 2,667(0,4); 2,506(58,2); 2,502(74,9); 2,497(58,0); 2,410(1,5); 2,405(2,0); 2,401(2,3); 2,391(1,2); 2,329(0,5); 1,989(0,5); 1,538(0,3); 1,236(1,0); 1,179(5,8); 1,170(1,7); 1,162(11,6); 1,144(6,1); 1,136(1,6); 1,112(13,8); 1,095(2,1); 1,083(1,2); 1,067(1,0); 0,941(0,6); 0,923(0,3); 0,629(0,4); 0,613(0,4); 0,146(0,4); 0,000(82,2); -0,150(0,4)$

10

Beispiel Ic-184:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 9,137(2,5); 9,124(2,6); 8,836(6,4); 8,825(1,1); 8,574(7,4); 8,561(0,6); 8,315(0,3); 7,838(2,0); 7,832(2,4); 7,817(2,4); 7,812(3,1); 7,803(0,7); 7,797(0,9); 7,788(5,0); 7,782(3,8); 7,764(0,8); 7,614(4,5); 7,593(4,0); 7,576(0,4); 7,552(0,3); 3,818(16,0); 3,803(1,4); 3,608(0,9); 3,596(1,1); 3,591(1,3); 3,583(1,2); 3,579(1,3); 3,571(1,3); 3,567(1,2); 3,554(1,0); 3,324(105,5); 3,306(5,8); 3,033(1,0); 2,824(1,0); 2,675(0,6); 2,671(0,7); 2,666(0,5); 2,511(42,7); 2,506(80,1); 2,502(105,9); 2,497(79,4); 2,493(42,4); 2,333(0,5); 2,329(0,7); 2,324(0,5); 2,081(1,7); 2,060(2,2); 2,056(2,1); 2,035(1,7); 1,735(1,9); 1,718(2,2); 1,714(2,0); 1,698(1,8); 1,235(0,7); 1,073(0,3); 1,056(0,6); 1,038(0,3); 0,146(0,6); 0,008(7,8); 0,000(139,6); -0,009(7,5); -0,012(5,0); -0,017(6,5); -0,150(0,6)$

15

20

Beispiel Ic-185:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 8,958(0,3); 8,945(5,1); 8,664(5,5); 8,379(2,0); 8,369(2,0); 8,316(0,8); 7,912(1,1); 7,907(1,1); 7,891(2,5); 7,886(2,6); 7,862(4,0); 7,841(1,7); 7,740(3,3); 7,736(3,1); 4,038(0,5); 4,020(0,5); 3,840(0,9); 3,824(13,0); 3,323(158,4); 3,294(2,1); 3,276(6,6); 3,258(6,7); 3,241(2,0); 2,774(0,5); 2,765(0,8); 2,756(1,2); 2,746(1,2); 2,737(0,8); 2,728(0,6); 2,675(1,2); 2,671(1,6); 2,666(1,2); 2,524(4,4); 2,511(94,1); 2,506(188,5); 2,502(246,3); 2,497(177,2); 2,493(84,7); 2,333(1,2); 2,328(1,6); 2,324(1,2); 1,989(2,2); 1,236(1,4); 1,193(0,6); 1,175(1,2); 1,157(0,6); 1,058(7,3); 1,040(16,0); 1,022(7,0); 0,692(0,6); 0,679(1,7); 0,674(2,6); 0,663(2,2); 0,656(2,1); 0,645(1,0); 0,580(1,0); 0,570(2,9); 0,562(2,6); 0,555(1,8); 0,542(0,7); 0,146(1,5); 0,008(12,7); 0,000(348,2); -0,009(13,4); -0,150(1,5)$

25

30

Beispiel Ic-186:  $^1\text{H-NMR}(601,6 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :

$\delta = 8,264(3,7); 8,239(3,4); 7,700(2,2); 7,697(2,4); 7,662(1,4); 7,659(1,1); 7,649(1,5); 7,645(1,3); 7,490(2,4); 7,476(2,0); 6,994(0,5); 3,749(10,3); 3,361(0,8); 3,351(0,8); 3,344(1,2); 3,333(1,3); 3,321(16,0); 3,314(0,5); 3,291(1,0); 3,281(1,2); 3,269(1,3); 3,264(0,8); 3,252(0,9); 3,042(0,7); 2,782(0,7); 2,776(1,0); 2,769(0,9); 2,763(0,7); 2,195(17,3); 2,190(16,0); 2,187(17,4); 2,186(17,0); 2,179(21,7); 1,967(0,9); 1,959(2,4); 1,954(3,1); 1,951(14,6); 1,947(25,5); 1,942(36,5); 1,938(24,2);$

35

$1,934(11,9); 1,313(0,4); 1,308(0,5); 1,303(0,6); 1,297(0,7); 1,292(0,6); 1,286(0,7); 1,281(0,5); 1,270(0,6); 0,836(0,5); 0,827(0,7); 0,820(1,0); 0,812(0,7); 0,804(0,6); 0,762(0,7); 0,752(1,1); 0,740(1,0); 0,730(0,5); 0,000(34,8); -0,006(1,4)$

40

Beispiel Ic-187:  $^1\text{H-NMR}(601,6 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 9,360(4,3); 8,842(6,0); 8,833(0,4); 8,589(6,5); 8,321(0,4); 7,805(0,5); 7,790(1,8); 7,786(2,2); 7,776(2,0); 7,772(2,7); 7,762(4,5); 7,758(3,0); 7,569(3,8); 7,555(3,4); 3,835(0,7); 3,823(16,0); 3,339(103,5); 3,319(23,1); 3,263(0,6); 2,615(0,7); 2,524(1,2); 2,521(1,5); 2,509(44,6); 2,506(94,0); 2,503(129,1); 2,500(95,8); 2,387(0,7); 1,989(0,4); 1,235(0,6); 1,057(1,3); 1,048(3,9); 1,045(4,2); 1,037(1,9); 0,916(1,8); 0,908(3,9); 0,905(4,4); 0,896(1,4); 0,096(0,4); 0,005(2,4); 0,000(86,7); -0,006(4,5); -0,019(0,5); -0,100(0,5)$

45

Beispiel Ic-188:  $^1\text{H-NMR}(601,6 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

$\delta = 19,967(0,6); 8,835(6,1); 8,674(4,1); 8,574(6,8); 8,321(0,5); 7,759(1,9); 7,755(2,1); 7,745(2,3); 7,742(2,6); 7,671(4,2); 7,667(3,9); 7,538(4,3); 7,524(4,0); 3,820(16,0); 3,339(162,7); 2,615(1,1); 2,524(1,4); 2,521(1,7); 2,518(1,8); 2,509(56,6); 2,506(123,8); 2,503(171,4); 2,500(124,0); 2,497(57,2); 2,387(1,0); 1,371(0,9); 1,366(0,9); 1,357(1,8); 1,349(1,0); 1,343(0,9); 1,335(0,5); 1,234(0,6); 0,715(1,4); 0,703(4,2); 0,696(1,7); 0,600(1,8); 0,593(4,0); 0,590(4,2); 0,581(1,4); 0,396(1,0); 0,389(2,7); 0,386(2,9); 0,379(1,4); 0,375(2,8); 0,372(2,8); 0,365(1,1); 0,242(1,1); 0,233(3,4); 0,224(3,3); 0,217(1,0); 0,097(0,7); 0,005(4,0); 0,000(121,0); -0,006(4,2); -0,100(0,4)$

50

55

Beispiel Ic-189:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 8,848(5,3); 8,835(1,8); 8,825(1,7); 8,601(5,4); 8,128(0,4); 8,107(7,5); 8,082(0,4); 8,053(3,7); 4,056(0,7); 4,038(2,2); 4,021(2,2); 4,003(0,8); 3,823(12,8); 3,326(36,5); 2,867(0,5); 2,858(0,8); 2,849(1,2); 2,840(1,2); 2,831(0,9); 2,821(0,8); 2,806(16,0); 2,672(0,4); 2,507(40,5); 2,503(50,7); 2,498(38,5); 2,330(0,3); 1,989(9,1); 1,193(2,4); 1,176(4,8); 1,158(2,4); 0,772(0,7); 0,754(2,7); 0,742(2,6); 0,737(2,2); 0,725(0,9); 0,619(1,0); 0,608(2,9); 0,602(2,9); 0,593(2,3); 0,581(0,7); 0,008(2,5); 0,000(38,0)$

10

Beispiel Ic-190:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 8,973(1,4); 8,687(1,7); 8,673(0,6); 7,994(0,8); 7,990(0,8); 7,979(1,2); 7,958(0,3); 7,849(0,9); 7,846(0,9); 4,056(1,4); 4,039(4,0); 4,021(4,1); 4,003(1,4); 3,830(3,5); 3,374(4,0); 3,324(6,0); 2,791(0,3); 2,507(6,6); 2,503(8,7); 2,498(6,7); 1,989(16,0); 1,398(0,5); 1,194(4,4); 1,176(8,5); 1,158(4,4); 0,709(0,5); 0,704(0,7); 0,692(0,7); 0,686(0,6); 0,590(0,8); 0,582(0,8); 0,575(0,6); 0,007(0,5); 0,000(7,4)$

15

Beispiel Ic-191:  $^1\text{H-NMR}(601,6 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 9,410(3,9); 8,303(5,0); 7,660(1,5); 7,656(1,6); 7,646(1,9); 7,642(2,2); 7,616(3,7); 7,612(2,9); 7,554(3,6); 7,540(2,9); 5,759(16,0); 5,492(4,7); 3,842(13,0); 3,340(32,5); 2,892(0,8); 2,732(0,7); 2,521(0,9); 2,509(20,9); 2,506(40,9); 2,503(52,9); 2,500(37,6); 2,497(17,5); 1,605(1,4); 1,596(3,3); 1,592(3,5); 1,583(1,4); 1,284(1,5); 1,275(3,2); 1,270(3,4); 1,261(1,3); 0,000(58,8); -0,006(2,5)$

20

Beispiel Ic-192:  $^1\text{H-NMR}(601,6 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 19,977(0,6); 8,512(2,3); 8,504(2,4); 8,321(0,4); 8,280(6,1); 7,952(1,0); 7,603(1,6); 7,600(2,0); 7,590(2,0); 7,586(2,7); 7,561(4,3); 7,558(3,5); 7,509(4,4); 7,495(3,4); 5,463(5,8); 4,034(1,0); 4,022(1,0); 3,842(16,0); 3,340(145,6); 2,891(6,5); 2,842(0,6); 2,836(0,9); 2,830(1,4); 2,823(1,3); 2,817(0,9); 2,811(0,7); 2,731(5,8); 2,614(0,8); 2,521(1,5); 2,518(1,6); 2,506(100,8); 2,503(140,1); 2,500(105,3); 2,387(0,9); 1,990(4,3); 1,187(1,1); 1,175(2,2); 1,163(1,1); 0,723(0,8); 0,715(2,5); 0,712(3,4); 0,703(3,2); 0,700(2,7); 0,692(1,0); 0,544(1,0); 0,536(3,2); 0,532(3,0); 0,526(2,9); 0,518(0,9); 0,096(0,4); 0,005(3,5); 0,000(99,9); -0,006(4,1); -0,100(0,4)$

25

30

Beispiel Ic-193:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 9,007(2,3); 8,987(2,3); 8,842(6,1); 8,584(6,6); 7,795(1,7); 7,790(2,0); 7,775(2,0); 7,769(2,6); 7,743(4,2); 7,738(3,5); 7,570(3,9); 7,549(3,3); 4,814(0,8); 4,808(0,9); 4,794(1,2); 4,791(1,2); 4,777(0,9); 4,772(0,8); 3,822(16,0); 3,326(108,0); 3,228(3,8); 3,222(4,0); 3,128(0,5); 3,123(0,5); 2,671(0,7); 2,506(75,4); 2,502(101,5); 2,498(81,0); 2,329(0,7); 2,324(0,6); 2,054(0,3); 2,035(0,6); 2,017(0,4); 1,405(8,6); 1,388(8,6); 1,359(0,3); 1,258(1,7); 1,234(9,3); 0,869(0,4); 0,854(1,1); 0,836(0,5); 0,000(7,1)$

35

Beispiel Ic-194:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ :  
 $\delta = 8,312(5,7); 8,260(5,4); 8,201(0,3); 7,765(3,1); 7,759(4,1); 7,732(2,2); 7,726(1,6); 7,711(2,4); 7,705(2,2); 7,584(0,6); 7,568(1,5); 7,526(3,8); 7,505(3,1); 6,822(0,3); 4,085(0,5); 4,068(1,4); 4,050(1,4); 4,032(0,5); 3,960(1,1); 3,805(16,0); 3,753(0,4); 2,135(117,2); 2,120(1,8); 2,113(1,9); 2,107(2,2); 2,101(1,5); 2,095(0,8); 1,972(6,8); 1,964(9,3); 1,958(22,9); 1,952(133,4); 1,946(243,9); 1,940(330,1); 1,934(228,3); 1,928(118,5); 1,781(0,8); 1,774(1,4); 1,768(1,9); 1,762(1,4); 1,756(0,7); 1,604(1,7); 1,590(4,3); 1,583(4,3); 1,569(2,2); 1,437(1,6); 1,366(2,2); 1,352(4,1); 1,345(4,4); 1,331(1,7); 1,222(1,7); 1,204(3,3); 1,186(1,6); 0,146(2,1); 0,008(14,0); 0,000(456,7); -0,009(17,3); -0,150(2,0)$

40

45

Beispiel Ic-196:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 8,952(6,2); 8,677(6,9); 8,592(2,3); 8,582(2,5); 7,957(1,5); 7,936(2,1); 7,845(3,7); 7,824(3,4); 7,803(2,5); 4,056(1,2); 4,039(3,6); 4,021(3,7); 4,003(1,3); 3,848(0,6); 3,833(16,0); 3,326(18,9); 2,833(0,6); 2,823(0,9); 2,814(1,4); 2,805(1,5); 2,796(1,0); 2,787(0,7); 2,507(22,6); 2,503(30,2); 2,498(23,6); 1,989(15,2); 1,193(4,1); 1,176(8,1); 1,158(4,1); 0,731(0,9); 0,718(2,6); 0,713(3,6); 0,701(3,5); 0,695(2,9); 0,684(1,2); 0,538(1,1); 0,528(3,4); 0,521(3,4); 0,518(3,3); 0,512(3,2);$

50

0,500(1,0); 0,000(1,7)

Beispiel Ic-197:  $^1\text{H-NMR}(600,1 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

55

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5

$\delta = 9,207(0,5); 8,978(6,0); 8,695(6,6); 7,986(1,5); 7,983(1,5); 7,972(2,6); 7,969(2,7); 7,934(4,4); 7,920(2,7); 7,800(3,9); 7,797(3,8); 7,713(0,9); 7,6044(0,9); 7,6035(0,9); 7,190(2,8); 7,185(2,9); 4,048(0,6); 4,036(1,7); 4,024(1,7); 4,012(0,6); 3,840(16,0); 3,740(2,6); 3,649(0,7); 3,637(1,0); 3,627(1,0); 3,615(0,8); 3,323(104,6); 3,311(1,6); 3,300(1,1); 3,289(0,8); 3,162(0,5); 3,150(0,8); 3,137(1,3); 3,125(1,2); 3,114(0,6); 3,102(1,0); 3,089(1,2); 3,077(0,8); 3,065(0,5); 2,615(0,4); 2,524(0,6); 2,521(0,7); 2,517(0,7); 2,508(20,7); 2,506(43,5); 2,503(59,4); 2,500(43,2); 2,497(20,5); 2,386(0,4); 2,210(0,8); 2,205(1,1); 2,200(1,0); 2,194(0,9); 2,183(0,4); 2,179(0,6); 1,989(7,5); 1,259(0,6); 1,236(8,3); 1,187(2,2); 1,180(4,2); 1,175(4,7); 1,169(8,6); 1,164(2,8);$

10

1,157(4,0); 1,057(4,0); 1,045(8,4); 1,033(3,9); 0,866(0,5); 0,854(1,2); 0,842(0,6); 0,561(0,6); 0,558(0,7); 0,549(1,4); 0,546(1,7); 0,542(1,1); 0,537(2,1); 0,523(1,6); 0,449(0,4); 0,440(0,6); 0,437(0,8); 0,429(0,9); 0,425(0,9); 0,422(0,7); 0,415(0,8); 0,410(0,4); 0,352(0,4); 0,345(0,7); 0,338(1,0); 0,332(1,0); 0,324(0,9); 0,318(0,5); 0,000(9,1); -0,006(0,3)

Beispiel Ic-198:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 8,916(2,2); 8,896(2,2); 8,838(6,3); 8,584(6,8); 8,317(0,3); 7,783(1,7); 7,778(2,0); 7,763(1,9); 7,757(2,8); 7,733(4,1); 7,728(3,2); 7,557(3,9); 7,536(3,3); 4,791(0,6); 4,786(0,6); 4,772(0,9); 4,769(0,9); 4,755(0,6); 4,749(0,6); 3,823(16,0); 3,327(108,6); 2,676(0,6); 2,671(0,8); 2,667(0,6); 2,506(85,8); 2,502(113,4); 2,498(85,7); 2,333(0,5); 2,329(0,7); 2,324(0,6); 2,104(0,6); 1,795(10,5); 1,789(10,6); 1,374(8,0); 1,356(8,0); 1,243(0,6); 1,235(0,7); 1,227(0,6); 0,008(1,1); 0,000(29,4); -0,008(1,4)$

15

20

Beispiel Ic-200:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 8,827(6,2); 8,662(4,1); 8,571(6,6); 7,759(1,8); 7,753(2,0); 7,738(2,1); 7,732(2,5); 7,692(4,2); 7,687(3,6); 7,535(4,1); 7,514(3,5); 5,757(2,1); 3,819(15,5); 3,327(61,1); 2,671(0,4); 2,667(0,3); 2,507(51,0); 2,502(67,0); 2,498(51,1); 2,333(0,3); 2,329(0,4); 2,325(0,3); 1,405(16,0); 1,235(0,6); 0,764(1,2); 0,747(4,3); 0,736(1,7); 0,620(1,9); 0,609(4,4); 0,605(4,5); 0,592(1,4); 0,000(2,3)$

25

Beispiel Ic-203:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 9,514(4,5); 8,974(6,1); 8,689(6,7); 8,023(1,6); 8,002(2,1); 7,900(3,7); 7,885(3,4); 7,864(2,5); 4,062(0,5); 4,044(1,6); 4,027(1,6); 4,009(0,6); 3,835(16,0); 3,337(104,4); 2,678(0,5); 2,513(60,3); 2,509(77,5); 2,505(58,9); 2,340(0,4); 2,336(0,5); 1,996(6,6); 1,626(1,6); 1,611(4,0); 1,605(4,2); 1,591(1,7); 1,266(1,9); 1,252(4,1); 1,246(4,5); 1,231(1,6); 1,199(1,8); 1,182(3,5); 1,164(1,8)$

30

Beispiel Ic-204:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 8,858(5,3); 8,801(1,4); 8,600(5,7); 8,535(1,4); 7,891(1,1); 7,854(0,6); 7,831(3,6); 7,826(4,4);$

35

$7,821(4,3); 7,814(3,4); 7,676(0,8); 7,655(0,7); 7,617(3,1); 7,606(1,0); 7,595(2,5); 4,056(1,2); 4,038(3,5); 4,021(3,5); 4,003(1,3); 3,827(16,0); 3,327(83,4); 3,191(0,7); 3,175(0,8); 3,058(0,8); 3,042(0,6); 2,677(0,4); 2,672(0,6); 2,668(0,4); 2,525(1,4); 2,512(29,9); 2,507(62,0); 2,503(84,7); 2,498(66,2); 2,494(36,1); 2,334(0,4); 2,330(0,6); 2,325(0,4); 1,989(15,1); 1,826(0,4); 1,806(0,8); 1,788(0,9); 1,747(1,8); 1,735(1,8); 1,714(1,1); 1,694(1,7); 1,676(2,7); 1,657(2,8); 1,639(1,6); 1,621(0,6); 1,583(0,8); 1,569(0,8); 1,398(1,3); 1,235(0,4); 1,193(4,1); 1,176(8,1); 1,158(4,0); 1,022(1,1); 1,004(2,1); 0,986(1,1); 0,813(3,9); 0,794(7,9); 0,776(3,6); 0,146(0,6); 0,008(4,6); 0,000(124,5); -0,008(8,8); -0,150(0,6)$

40

Beispiel Ic-205:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 8,801(6,3); 8,544(6,9); 7,954(2,7); 7,949(2,9); 7,860(2,0); 7,855(1,8); 7,839(2,3); 7,834(2,3); 7,630(4,2); 7,609(3,6); 4,056(0,5); 4,038(1,6); 4,020(1,6); 4,003(0,6); 3,816(16,0); 3,323(61,4); 2,835(0,7); 2,818(1,9); 2,801(1,9); 2,784(0,8); 2,675(0,4); 2,671(0,5); 2,667(0,4); 2,511(27,8); 2,507(55,4); 2,502(73,8); 2,498(55,9); 2,333(0,4); 2,329(0,5); 2,324(0,4); 1,989(6,9); 1,843(2,0); 1,581(0,9); 1,236(0,3); 1,193(1,8); 1,175(3,6); 1,157(1,8); 1,058(4,6); 1,040(9,7); 1,022(4,5); 1,005(0,4); 0,986(0,6); 0,146(0,3); 0,008(2,8); 0,000(71,2); -0,008(3,9); -0,150(0,3)$

45

Beispiel Ic-206:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :  
 $\delta = 8,835(0,7); 8,580(0,7); 7,832(0,7); 7,617(0,4); 3,823(2,9); 3,323(14,6); 2,525(0,4); 2,511(8,0); 2,507(15,6); 2,502(20,3); 2,498(14,9); 2,494(7,6); 1,689(0,5); 1,398(16,0); 0,008(0,8); 0,000(20,3); -0,009(1,0)$

50

Beispiel Ic-207:  $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)$ :

55

EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5	<p><math>\delta = 8,838(6,2); 8,577(6,7); 8,423(2,0); 8,402(2,0); 8,316(0,3); 7,773(1,7); 7,767(1,9); 7,752(2,0); 7,747(2,4); 7,700(4,1); 7,695(3,5); 7,556(3,9); 7,535(3,2); 3,822(16,0); 3,540(0,7); 3,521(1,3); 3,504(1,3); 3,484(0,7); 3,322(69,5); 2,671(1,0); 2,506(113,3); 2,502(143,2); 2,498(107,4); 2,332(0,7); 2,329(0,9); 1,223(8,6); 1,206(8,4); 0,957(0,4); 0,949(0,6); 0,937(1,2); 0,930(0,8); 0,925(0,9); 0,917(1,2); 0,905(0,7); 0,897(0,5); 0,469(0,4); 0,460(1,0); 0,452(0,9); 0,447(1,1); 0,438(1,3); 0,426(0,7); 0,416(1,0); 0,404(0,9); 0,392(1,0); 0,384(1,2); 0,371(1,5); 0,360(1,2); 0,350(1,6); 0,338(1,5); 0,327(1,1); 0,314(0,4); 0,289(0,6); 0,277(1,1); 0,267(1,4); 0,255(1,1); 0,245(0,7); 0,146(0,6); 0,000(120,2); -0,150(0,6)</math></p>
10	<p>Beispiel Ic-208: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,858(3,7); 8,826(0,3); 8,804(0,8); 8,601(3,9); 8,572(0,4); 8,539(0,8); 7,907(0,6); 7,840(3,2); 7,834(2,3); 7,813(1,6); 7,808(1,2); 7,673(0,5); 7,652(0,4); 7,623(2,2); 7,602(1,8); 4,056(1,2); 4,038(3,7); 4,020(3,7); 4,003(1,3); 3,825(13,4); 3,639(0,5); 3,327(64,3); 3,255(0,5); 3,251(0,5); 3,244(0,5); 3,184(0,4); 3,171(0,5); 2,676(0,3); 2,672(0,4); 2,667(0,3); 2,525(1,1); 2,512(24,7); 2,507(50,0); 2,503(66,9); 2,498(49,5); 2,494(24,6); 2,399(0,7); 2,329(0,4); 1,989(16,0); 1,741(1,8);</math></p>
15	<p><math>1,541(0,5); 1,482(0,4); 1,422(0,6); 1,398(0,6); 1,355(0,8); 1,337(1,4); 1,320(0,7); 1,226(2,4); 1,208(4,9); 1,193(5,8); 1,175(8,7); 1,158(4,4); 1,140(0,4); 0,146(0,5); 0,008(3,7); 0,000(100,2); -0,009(4,3); -0,019(0,4); -0,150(0,5)</math></p>
20	<p>Beispiel Ic-209: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 10,636(4,3); 8,860(6,2); 8,619(6,9); 8,316(0,9); 7,988(3,8); 7,982(4,2); 7,860(1,9); 7,855(1,8); 7,839(2,3); 7,834(2,3); 7,780(2,6); 7,768(2,9); 7,763(1,9); 7,758(3,1); 7,750(1,3); 7,745(2,9); 7,646(4,2); 7,625(3,6); 7,234(2,8); 7,229(1,1); 7,212(5,1); 7,195(1,0); 7,190(2,7); 3,854(0,3); 3,829(16,0); 3,568(0,5); 3,322(169,4); 2,675(1,3); 2,671(1,8); 2,666(1,4); 2,524(4,5); 2,510(96,1); 2,506(197,9); 2,502(268,1); 2,497(204,6); 2,493(108,0); 2,333(1,3); 2,328(1,8); 2,324(1,3); 1,672(0,4); 1,234(0,6); 0,146(1,1); 0,008(8,7); 0,000(241,9); -0,008(13,3); -0,150(1,1)</math></p>
25	<p>Beispiel Ic-210: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, DMSO-}d_6)</math>:  <math>\delta = 8,822(6,3); 8,657(4,3); 8,576(0,4); 8,564(6,8); 8,316(0,5); 7,759(1,9); 7,754(2,0); 7,738(2,2); 7,733(2,5); 7,654(4,1); 7,649(3,9); 7,539(4,3); 7,518(3,6); 7,269(0,3); 7,250(0,9); 7,231(0,8); 7,182(1,0); 7,164(0,8); 7,143(0,4); 3,817(16,0); 3,322(100,0); 2,696(0,8); 2,675(2,1); 2,655(1,1); 2,633(0,4); 2,524(2,1); 2,510(52,8); 2,506(107,9); 2,502(145,2); 2,497(111,4); 2,333(0,7); 2,328(1,0); 2,324(0,7); 2,300(4,0); 1,989(0,6); 1,918(0,4); 1,890(1,4); 1,870(2,0); 1,854(1,0); 1,845(0,7); 1,833(0,6); 1,808(1,4); 1,783(1,9); 1,766(2,4); 1,752(1,8); 1,744(1,4); 1,729(0,5); 1,720(1,0); 1,697(0,6); 1,667(0,8); 1,653(1,3); 1,632(0,8); 1,625(0,6); 1,398(0,6); 1,234(3,7); 1,175(0,4); 0,854(0,6); 0,727(0,6); 0,704(5,0); 0,679(4,8); 0,656(0,7); 0,146(0,6); 0,008(4,9); 0,000(138,6); -0,008(8,8); -0,150(0,7)</math></p>
30	<p>Beispiel Id-1: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)</math>:  <math>\delta = 7,969(0,6); 7,962(4,0); 7,957(2,5); 7,946(3,0); 7,938(2,1); 7,577(1,0); 7,565(2,7); 7,557(0,6); 7,549(0,6); 7,542(2,3); 7,040(3,0); 7,033(2,9); 3,771(11,0); 2,132(64,2); 2,119(0,8); 2,113(0,9); 2,107(1,1); 2,101(0,8); 2,095(0,4); 1,964(9,7); 1,958(15,9); 1,952(71,5); 1,946(125,4); 1,940(163,3); 1,933(110,9); 1,927(56,4); 1,914(0,8); 1,780(0,4); 1,774(0,7); 1,768(1,0); 1,762(0,7); 1,756(0,3); 1,594(1,1); 1,579(2,8); 1,572(2,7); 1,559(1,5); 1,437(16,0); 1,372(0,6); 1,367(1,6); 1,353(2,7); 1,346(2,9); 1,332(1,2); 1,277(0,6); 1,135(1,3); 0,146(0,7); 0,008(6,3); 0,000(168,8); -0,009(5,4); -0,150(0,7)</math></p>
35	<p>Beispiel Id-2: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)</math>:  <math>\delta = 7,937(3,0); 7,930(3,0); 7,919(2,4); 7,914(7,2); 7,908(0,8); 7,893(2,6); 7,888(1,7); 7,526(2,8); 7,506(2,6); 7,026(4,1); 7,019(4,0); 6,923(0,9); 5,447(2,7); 4,085(0,6); 4,068(1,7); 4,050(1,8); 4,032(0,6); 3,770(16,0); 2,867(0,7); 2,858(1,0); 2,849(1,5); 2,840(1,5); 2,831(1,0); 2,822(0,7); 2,609(1,4); 2,135(16,5); 1,971(7,8); 1,964(2,4); 1,958(3,9); 1,952(17,6); 1,946(31,0); 1,940(40,5); 1,934(27,6); 1,927(14,2); 1,437(4,7); 1,270(0,5); 1,221(2,0); 1,204(4,0); 1,186(2,0); 1,135(13,3);</math></p>
40	<p><math>0,792(0,8); 0,780(2,4); 0,774(3,2); 0,762(3,3); 0,757(2,4); 0,744(1,1); 0,611(1,1); 0,600(2,8); 0,594(2,9); 0,590(2,5); 0,585(2,5); 0,572(0,8); 0,008(1,6); 0,000(41,8); -0,009(1,5)</math></p>
45	<p>Beispiel le-1: <math>^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)</math>:</p>
50	
55	

## EP 2 953 942 B1

(fortgesetzt)

5	$\delta = 8,652(4,8); 8,189(8,6); 8,170(2,7); 8,165(1,7); 7,625(3,1); 7,622(2,7); 7,606(2,1); 7,603(2,6); 7,347(0,4); 6,877(0,3); 6,872(0,7); 4,068(0,5); 4,050(0,5); 3,813(16,0); 2,727(0,3); 2,131(44,1); 2,119(0,8); 2,113(1,0); 2,107(1,1); 2,101(0,8); 2,095(0,5); 1,971(3,2); 1,964(10,3); 1,958(17,6); 1,952(79,9); 1,946(140,5); 1,940(183,6); 1,933(124,7); 1,927(63,7); 1,780(0,4); 1,774(0,8); 1,768(1,1); 1,762(0,7); 1,756(0,4); 1,590(1,6); 1,576(4,0); 1,569(3,9); 1,555(2,1); 1,543(0,5); 1,437(3,4); 1,380(2,2); 1,367(3,9); 1,360(4,0); 1,345(1,6); 1,312(0,5); 1,306(0,5); 1,222(0,6); 1,204(1,2); 1,186(0,6); 0,146(1,1); 0,008(10,0); 0,000(243,3); -0,009(8,3); -0,150(1,1)$
10	Beispiel le-2: $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ : $\delta = 8,645(4,8); 8,148(2,7); 8,144(4,8); 8,140(4,0); 8,134(1,4); 8,119(2,7); 8,114(1,9); 7,691(0,3); 7,587(3,2); 7,586(3,1); 7,566(2,8); 7,565(2,9); 6,966(1,0); 6,838(0,7); 4,068(0,3); 3,811(16,0); 2,867(0,8); 2,858(1,1); 2,849(1,7); 2,840(1,7); 2,831(1,1); 2,822(0,8); 2,812(0,4); 2,132(52,6); 2,113(1,6); 2,107(1,5); 2,101(1,1); 2,095(0,6); 1,971(3,9); 1,964(14,4); 1,958(25,4); 1,952(99,3); 1,946(172,4); 1,940(222,3); 1,933(152,6); 1,927(78,9); 1,780(0,5); 1,774(1,0); 1,768(1,2); 1,762(0,9); 1,756(0,4); 1,437(1,1); 1,222(0,4); 1,204(0,8); 1,196(0,3); 1,186(0,4); 1,178(0,5); 1,135(1,1); 0,793(0,9); 0,781(2,7); 0,776(3,5); 0,763(3,8); 0,758(2,7); 0,746(1,5); 0,728(0,4); 0,724(0,3); 0,618(1,3); 0,606(3,1); 0,600(3,3); 0,596(2,9); 0,591(2,8); 0,578(0,9); 0,556(0,4); 0,146(1,2); 0,008(14,7); 0,000(291,0); -0,009(14,1); -0,150(1,2)$
15	
20	Beispiel le-3: $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ : $\delta = 8,651(5,0); 8,520(3,2); 8,275(1,8); 8,256(1,8); 7,889(1,6); 7,869(1,8); 7,609(1,8); 7,590(3,2); 7,571(1,5); 7,209(0,8); 3,823(16,0); 2,888(0,6); 2,879(0,9); 2,870(1,3); 2,861(1,3); 2,852(0,9); 2,842(0,6); 2,135(28,8); 2,113(0,3); 2,107(0,4); 1,972(1,2); 1,964(3,8); 1,958(6,2); 1,952(26,3); 1,946(45,9); 1,940(59,5); 1,934(40,7); 1,927(20,9); 1,768(0,3); 1,320(0,3); 1,204(0,4); 0,784(0,7); 0,772(2,1); 0,766(2,9); 0,754(2,9); 0,748(2,2); 0,737(1,0); 0,645(1,1); 0,634(2,9); 0,627(2,8); 0,618(2,2); 0,606(0,7); 0,008(2,9); 0,000(61,7); -0,008(2,4)$
25	
30	Beispiel le-4: $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ : $\delta = 8,652(2,7); 8,562(1,0); 8,558(1,8); 8,298(1,0); 8,279(1,0); 7,934(0,8); 7,914(1,0); 7,738(0,4); 7,634(1,0); 7,614(1,7); 7,595(0,8); 7,292(1,0); 7,289(1,1); 7,280(1,1); 7,277(1,2); 7,053(0,9); 7,045(1,1); 6,978(1,1); 6,969(1,0); 6,965(1,1); 6,956(0,8); 4,739(2,7); 4,724(2,7); 3,822(8,6); 2,134(24,0); 2,132(32,1); 2,113(0,4); 2,107(0,5); 2,101(0,3); 1,964(3,8); 1,958(6,4); 1,952(27,1); 1,946(47,3); 1,940(62,1); 1,933(42,8); 1,927(22,3); 1,768(0,4); 1,437(16,0); 0,008(2,9); 0,000(66,1); -$
	0,008(3,0)
35	Beispiel le-5: $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ : $\delta = 9,121(1,3); 8,734(2,8); 8,728(2,8); 8,706(2,0); 8,702(3,4); 8,698(2,0); 8,681(4,9); 8,375(1,8); 8,372(1,3); 8,355(1,9); 8,352(1,3); 8,234(1,9); 8,227(1,9); 8,212(2,0); 8,205(1,9); 8,084(1,2); 8,081(1,5); 8,077(1,2); 8,065(1,3); 8,061(1,7); 8,058(1,3); 7,711(1,8); 7,692(3,2); 7,672(1,5); 7,422(3,2); 7,401(2,9); 5,447(6,3); 3,837(16,0); 3,249(0,4); 2,136(132,2); 2,120(1,0); 2,113(1,1); 2,107(1,3); 2,101(1,0); 2,095(0,5); 1,964(12,5); 1,958(20,8); 1,952(85,5); 1,946(150,6); 1,940(195,4); 1,934(132,9); 1,927(67,6); 1,780(0,5); 1,774(0,8); 1,768(1,1); 1,762(0,8); 1,756(0,4); 1,437(1,0); 1,372(0,7); 1,277(1,0); 1,270(0,7); 0,146(0,9); 0,008(8,9); 0,000(195,9); -0,009(7,6); -0,150(0,9)$
40	
45	Beispiel le-6: $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ : $\delta = 8,667(5,3); 8,604(1,9); 8,600(3,4); 8,596(1,9); 8,311(1,8); 8,292(1,9); 8,144(0,7); 8,084(0,6); 7,970(1,2); 7,967(1,6); 7,963(1,2); 7,950(1,4); 7,947(1,8); 7,817(1,6); 7,648(1,8); 7,629(3,2); 7,609(1,5); 5,448(6,9); 4,068(0,6); 4,050(0,6); 3,829(16,0); 2,888(1,3); 2,770(1,2); 2,726(0,4); 2,158(26,7); 1,972(3,4); 1,964(6,0); 1,958(4,0); 1,953(14,1); 1,946(21,9); 1,940(27,7); 1,934(18,8); 1,928(9,6); 1,436(0,6); 1,372(1,9); 1,361(4,7); 1,352(4,5); 1,341(1,7); 1,221(0,7); 1,204(1,3); 1,186(0,7); 0,008(1,0); 0,000(25,7); -0,009(1,0)$
50	Beispiel le-7: $^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz, Acetontril-}d_3)$ : $\delta = 8,667(2,7); 8,555(1,9); 8,331(1,0); 8,315(0,8); 8,312(1,1); 7,952(0,8); 7,943(1,0); 7,941(1,2); 7,924(0,9); 7,921(1,1); 7,920(1,1); 7,653(1,0); 7,634(1,7); 7,614(0,8); 3,828(9,1); 2,167(64,5); 1,972(1,0); 1,965(3,2); 1,959(5,5); 1,953(22,7); 1,947(39,7); 1,940(51,6); 1,934(35,6); 1,928(18,4); 1,575(0,9); 1,561(2,3); 1,553(2,3); 1,540(1,2); 1,437(16,0); 1,376(1,2); 1,363(2,3); 1,356(2,3); 1,341(0,9); 0,008(2,2); 0,000(49,3); -0,009(2,3)$

### 55 Herstellung der Ausgangsverbindungen

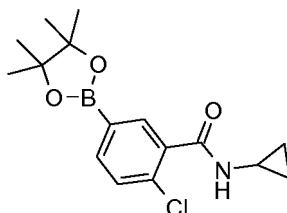
**[0230]** Alle eingesetzten Ausgangsverbindungen sind entweder nach oder in Analogie zu literaturbekannten Verfahren darstellbar oder sind kommerziell erhältlich. So kann zum Beispiel 5-Fluor-1-methyl-3-(pentafluorethyl)-4-(trifluormethyl)-

1H-pyrazol nach der einer literaturbekannten Methode dargestellt werden [Russian Chemical Bulletin 1990, 39, 11, 2338 - 2344].

[4-Chlor-3-(methoxycarbonyl)phenyl]boronsäure ist z.B. kommerziell erhältlich.

### Herstellung von 2-Chlor-N-cyclopropyl-5-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)benzamid

[0231]



[0232] Man löst 75,0 g (318 mmol) 5-Brom-2-chlorbenzoesäure in 1,50 L Dimethylformamid und fügt 156 g (1,59 mol) Kaliumacetat hinzu. Das Reaktionsgemisch wird entgast und dann mit 26,0 g (31,8 mmol) 1,1'-Bis(diphenylphosphin)ferrocen-palladium(II)dichlorid Dichloromethan versetzt und abermals entgast. Danach wird das Gemisch 30 Minuten auf 80°C erhitzt und wieder auf Raumtemperatur abgekühlt. Dann werden 121 g (477 mmol) Bis(pinakolat)diboron hinzugefügt und das Reaktionsgemisch 4h bei 80°C gerührt. Nach dem Abkühlen auf Raumtemperatur wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird mit 500 mL 2M Natronlauge aufgenommen. Die wässrige Phase wird dreimal mit je 500 mL Ethylacetat gewaschen. Mit 2M Salzsäure wird die wässrige Phase angesäuert, der dabei ausfallende Feststoff wird filtriert und unter vermindertem Druck getrocknet.

[0233] Man erhält 70,0 g 2-Chlor-5-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)benzoesäure in Form eines graufarbenen Feststoffs. Dieser kann ohne weitere Aufreinigung weiter umgesetzt.

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, d<sub>6</sub>-Dimethylsulfoxid): δ = 8,05 (d, 1H), 7,76 (dd, 1H), 7,56 (d, 1H), 1,30 (s, 12H) ppm.

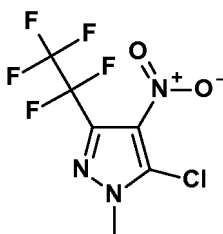
[0234] 25,0 g (88,5 mmol) 2-Chlor-5-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)benzoesäure werden in 850 mL Dimethylformamid gelöst und anschließend mit 33,7g (88,5 mmol) HATU (1-[Bis(dimethylamino)methylen]-1H-1,2,3-triazol[4,5-b]pyridinium 3-oxid hexafluorophosphat) versetzt. Die Reaktion wird 15 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Es werden nach einander 35,4 mL (199 mmol) N-Ethyl-diisopropylamin und 7,50 mL (106 mmol) Cyclopropylamin zu der Reaktionslösung hinzugefügt. Nach 16h bei Raumtemperatur wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird mit Wasser aufgenommen und anschließend das Produkt dreimal mit je 500 mL Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und das Lösungsmittel unter vermindertem Druck entfernt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

Man erhält 16,6 g 2-Chlor-N-cyclopropyl-5-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)benzamid als farblosen Feststoff.

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, d<sub>6</sub>-Dimethylsulfoxid): δ = 8,50 (d, 1H), 7,66 (dd, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 2,77-2,83 (m, 1H), 1,29 (s, 12H), 0,66-0,71 (m, 2H), 0,51-0,55 (m, 2H) ppm.

### Herstellung von 5-Chlor-1-methyl-4-nitro-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol

[0235]



[0236] 3,80 g (Reinheit 70%, 13,2 mmol) 1-Methyl-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol [European Journal of Organic Chemistry 2002, 17, 2913-2920] werden portionsweise zu einer auf 70°C erwärmten Mischung aus 5,79 mL konz. Salpetersäure (rauchend) und 15,7 mL konz. Schwefelsäure gegeben, so dass die Innentemperatur nicht 90°C übersteigt. Nach der Zugabe wird die Reaktionslösung 2h bei 75°C Innentemperatur weiter gerührt. Nach dem Abkühlen der Reaktionsmischung

## EP 2 953 942 B1

chung auf Raumtemperatur, wird die Reaktionsmischung auf Eis gegossen. Die wässrige Phase wird zweimal mit je 50 mL Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden mit 1N Salzsäure und gesättigter Kochsalzlösung gewaschen. Die organische Phase wird über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck eingeeengt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt.

Man erhält 3,00 g 1-Methyl-4-nitro-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{d}_3$ -Acetonitril):  $\delta = 8,52$  (d, 1H), 3,95 (s, 3H) ppm.

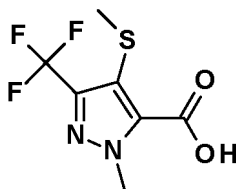
HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 2,51, Masse (m/z) = 246 [M+H]<sup>+</sup>.

**[0237]** 980 mg (3,99 mmol) 1-Methyl-4-nitro-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol in THF abs. gelöst und auf  $-78^\circ\text{C}$  gekühlt. Zu dieser Lösung werden tropfenweise 3,00 mL (5,99 mmol) 2M Lithiumdiisopropylamid Lösung zugefügt und 30 Minuten bei  $-78^\circ\text{C}$  nachgerührt. In einem zweiten Kolben werden 947 mg (3,99 mmol) Hexachlorethan gelöst in THF abs. vorgelegt und auf  $-78^\circ\text{C}$  gekühlt. Die erste Lösung wird langsam zu der zweiten Lösung getropft, so dass die Innentemperatur nicht  $-70^\circ\text{C}$  übersteigt. Die Reaktion wird eine Stunde bei  $-78^\circ\text{C}$  nachgerührt. Die Reaktion wird durch Zugabe von ges. Natriumhydrogencarbonat Lösung gequenchet. Die Reaktionsmischung wird auf RT erwärmt. Die Mischung wird mehrfach mit Ethylacetat extrahiert, die vereinigten organischen Phasen werden über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und am Rotationsverdampfer bei 30 mbar und  $37^\circ\text{C}$  Wasserbadtemperatur eingeeengt.

**[0238]** Man erhält 1,74 g (Reinheit ca. 25%) 5-Chlor-1-methyl-4-nitro-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol. Das Rohprodukt wird ohne weitere Aufarbeitung weiter umgesetzt.

### Herstellung von 1-Methyl-4-(methylsulfanyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure

**[0239]**



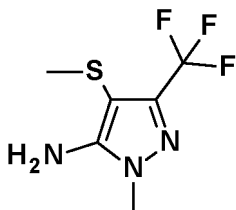
**[0240]** In Analogie zur Herstellung 1-Methyl-4-(methylsulfanyl)-3-(pentafluorethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure [WO2013-092522] wurde 1-Methyl-4-(methylsulfanyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure ausgehend von kommerziell erhältlicher 1-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure hergestellt.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{d}_6$ -DMSO- $\text{d}_6$ ):  $\delta = 4,10$  (s, 3H), 2,34 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 1,72, Masse (m/z) = 241 [M+H]<sup>+</sup>.

### Herstellung von 1-Methyl-4-(methylsulfanyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-amin

**[0241]**



**[0242]** 600 mg (2,49 mmol) 1-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-carbonsäure wird in einer Mischung aus 40 mL Toluol abs. und 357  $\mu\text{L}$  (2,56 mmol) Triethylamin gelöst. Die Lösung wird auf  $0^\circ\text{C}$  gekühlt und dann tropfenweise mit 704 mg (2,56 mmol) Diphenylphosphorylazid versetzt. Die Reaktionsmischung 16h bei  $100^\circ\text{C}$  Ölbadtemperatur gerührt. Der Ansatz wird auf RT abgekühlt und dann vorsichtig am Rotationsverdampfer bis zur Trockene eingeeengt. Der Rückstand wird in 2mL tert.-Butanol aufgenommen und dann 1h bei  $120^\circ\text{C}$  in der Mikrowelle erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird am Rotationsverdampfer zur Trockene eingeeengt. Der Rückstand wird in 6 mL Dichlormethan aufgenommen und dann mit 4,35 mL Trifluoressigsäure versetzt. Die Mischung wird 16h bei RT gerührt. Das Reaktionsgemisch wird am Rotationsverdampfer eingeeengt. Anschließend wird der Rückstand in Ethylacetat aufgenommen und zweimal mit 1N Natronlauge gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und am Rotationsverdampfer eingeeengt.

**[0243]** Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch an Kieselgel aufgereinigt. Man erhält 130 mg 1-Methyl-4-(me-

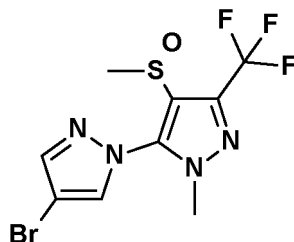
thylsulfanyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-amin.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $d_6$ -DMSO- $d_6$ ):  $\delta$  = 5,90 (s, 2H), 3,60 (s, 3H), 2,10 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 1,66, Masse (m/z) = 212 [M+H]<sup>+</sup>.

## 5 Herstellung von 4-Brom-2'-methyl-4'-(methylsulfinyl)-5'-(trifluormethyl)-2'H-1,3'-bipyrazol

[0244]



[0245] 130 mg (0.61 mmol) 1-Methyl-4-(methylsulfanyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-5-amin werden in 14 mL Acetonitril abs. gelöst und zu einer auf 70°C erwärmten Suspension aus 146  $\mu\text{L}$  (1.23 mmol) tert-Butylnitrit, 99,3 mg (0.73 mmol) Kupfer(II)chlorid und 29 mL Acetonitril abs. getropft. Die Reaktionsmischung 7h bei 70°C gerührt, auf RT abgekühlt und dann auf 75 mL 1N Salzsäure gegossen. Das Rophprodukt wird mehrfach mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit ges. Kochsalzlösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und dann unter vermindertem Druck am Rotationsverdampfer zur Trockene eingeeengt.

[0246] Man erhält als Rohprodukt 219 mg 5-Chlor-1-methyl-4-(methylsulfinyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol. Das Rohprodukt wurde ohne weitere Aufreinigung weiter eingesetzt.

GC-MS: Index = 1212, Masse (m/z) = 230.

[0247] 200 mg (Gehalt ca. 60%, ca. 0,52 mmol) 5-Chlor-1-methyl-4-(methylsulfinyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol werden in 5 mL Dichlormethan p.a. gelöst und dann mit einem Eisbad gekühlt. Man gibt portionsweise 64 mg (Gehalt ca. 70%, 0,26 mmol) 3-Chlor-perbenzoesäure dazu. Die Reaktion wird nach 3h unter Eiskühlung gerührt und dann mit 30 mL Dichlormethan p.a. verdünnt. Die organische Phase wird dann solange mit ges. Natriumhydrogencarbonatlösung gewaschen bis die org. Peroxidfrei ist. Anschließend wird die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck zur Trockene eingeeengt.

[0248] Man erhält als Rohprodukt 199 mg 5-Chlor-1-methyl-4-(methylsulfinyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol. Das Rohprodukt wird ohne weitere Aufreinigung in den Nachfolgereaktionen eingesetzt.

GC-MS: Index = 1454, Masse (m/z) = 246.

[0249] 199 mg (Gehalt ca. 60%, 0,48 mmol) 5-Chlor-1-methyl-4-(methylsulfinyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol und 135 mg (0,88 mmol) 4-Brom-1H-pyrazol werden in 3 mL Dimethylformamid p.a. gelöst und anschließend mit 526 mg (1,61 mmol) Cäsiumcarbonat versetzt. Das Reaktionsgemisch wird bei 100°C Ölbadtemperatur solange erhitzt bis kein Edukt mehr detektiert werden kann. Das Gemisch wird filtriert und mit tert-Butyl-methylether verdünnt. Die organische Phase wird dann mit 1N Salzsäure und ges. Kochsalzlösung gewaschen. Anschließend wird die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet und am Rotationsverdampfer unter vermindertem Druck eingeeengt. Das Rohprodukt wird dann an Kieselgel säulenchromatographisch gereinigt.

[0250] Man erhält 61 mg 4-Brom-2'-methyl-4'-(methylsulfinyl)-5'-(trifluormethyl)-2'H-1,3'-bipyrazol.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $d_3$ -Acetonitril):  $\delta$  = 8,13 (s, 1H), 7,91 (s, 1H), 3,77 (s, 3H), 2,73 (s, 3H) ppm.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 1,90, Masse (m/z) = 359 [M+H]<sup>+</sup>.

## Biologische Ausführungsbeispiele für Verwendungen im Bereich Tiergesundheit I.

### A. Amblyomma hebraeum -Test (AMBYHE)

[0251]

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

[0252] Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5 ml Dimethylsulfoxid und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

[0253] Zeckennymphen (*Amblyomma hebraeum*) werden in perforierte Plastikbecher gesetzt und in der gewünschten

Konzentration eine Minute getaucht. Die Zecken werden auf Filterpapier in eine Petrischale überführt und in einem Klimaschrank gelagert.

[0254] Nach 42 Tagen wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Zecken abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine der Zecken abgetötet wurde.

[0255] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ia-1, Ia-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-11, Ic-16, Ic-21, Ic-23, Ic-24, Ic-27, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-47, Ic-49, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-87, Ic-91, Ic-94, Ic-95

### **B. Boophilus microplus - Diptest (BOOPMI Dip)**

[0256]

Testtiere: Rinderzecken (*Boophilus microplus*) Stamm Parkhurst, SP-resistent  
 Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

[0257] 10 mg Wirkstoff werden in 0,5 ml Dimethylsulfoxid gelöst. Zwecks Herstellung einer geeigneten Formulierung verdünnt man die Wirkstofflösung mit Wasser auf die jeweils gewünschte Konzentration.

[0258] Diese Wirkstoffzubereitung wird in Röhrchen pipettiert. 8-10 gesogene, adulte, weibliche Rinderzecken (*Boophilus microplus*) werden in ein weiteres Röhrchen mit Löchern überführt. Das Röhrchen wird in die Wirkstoffzubereitung getaucht wobei alle Zecken vollständig benetzt werden. Nach Abfließen der Flüssigkeit werden die Zecken auf Filterscheiben in Kunststoffschalen überführt und in einem klimatisierten Raum aufbewahrt.

[0259] Die Wirkungskontrolle erfolgt nach 7 Tagen auf Ablage fertiler Eier. Eier, deren Fertilität nicht äußerlich sichtbar ist, werden bis zum Larvenschlupf nach etwa 42 Tagen im Klimaschrank aufbewahrt. Eine Wirkung von 100 % bedeutet, dass keine der Zecken fertile Eier gelegt hat, 0% bedeutet, dass alle Eier fertil sind.

[0260] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-11, Ic-16, Ic-21, Ic-23, Ic-24, Ic-27, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-47, Ic-49, Ic-65, Ic-66, Ic-77, Ic-78, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-91, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-109, Ic-111, Ic-112, Ic-113, Ic-130, Ic-139, Ic-147, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-158, Ic-160, Ic-164, Ic-166

[0261] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-97, Ic-103, Ic-175

[0262] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-29, Ic-48, Ic-80, Ic-159

### **C. Boophilus microplus -Injektionstest (BOOPMI Inj)**

[0263]

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

[0264] Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5 ml Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Lösungsmittel auf die gewünschte Konzentration.

[0265] 1 µl der Wirkstofflösung wird in das Abdomen von 5 vollgesogenen, adulten, weiblichen Rinderzecken (*Boophilus microplus*) injiziert. Die Tiere werden in Schalen überführt und in einem klimatisierten Raum aufbewahrt.

[0266] Die Wirkungskontrolle erfolgt nach 7 Tagen auf Ablage fertiler Eier. Eier, deren Fertilität nicht äußerlich sichtbar ist, werden bis zum Larvenschlupf nach etwa 42 Tagen im Klimaschrank aufbewahrt. Eine Wirkung von 100 % bedeutet, dass keine der Zecken fertile Eier gelegt hat, 0% bedeutet, dass alle Eier fertil sind.

[0267] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 20 µg/Tier: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-3, Ic-4, Ic-6, Ic-7, Ic-8, Ic-10, Ic-11, Ic-12, Ic-13, Ic-14, Ic-16, Ic-17, Ic-18, Ic-19, Ic-20, Ic-21, Ic-22, Ic-23, Ic-24, Ic-25, Ic-27, Ic-28, Ic-29, Ic-32, Ic-33, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-38, Ic-39, Ic-40, Ic-41, Ic-42, Ic-43, Ic-44, Ic-46, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-53, Ic-54, Ic-55, Ic-56, Ic-58, Ic-59, Ic-60, Ic-61, Ic-62, Ic-63, Ic-64, Ic-65, Ic-66, Ic-67, Ic-68, Ic-70, Ic-71, Ic-72, Ic-73, Ic-74, Ic-75, Ic-76, Ic-77, Ic-78, Ic-80, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-88, Ic-89, Ic-90, Ic-91, Ic-92, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-97, Ic-99, Ic-103, Ic-106, Ic-136, Ic-137, Ic-139, Ic-140, Ic-147, Ic-149, Ic-150, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-154, Ic-157, Ic-158, Ic-159, Ic-160, Ic-161, Ic-163, Ic-164, Ic-165, Ic-166, Ic-174, Ic-175, Id-1, Id-2, Ie-1

[0268] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 20 µg/Tier: Ic-156

[0269] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei

einer Aufwandmenge von 20µg/Tier: Ic-15, Ic-35

**D. Ctenocephalides felis - Oraltest (CTECFE)**

5 [0270]

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

10 [0271] Zwecks Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5 ml Dimethylsulfoxid. Durch Verdünnen mit citriertem Rinderblut erhält man die gewünschte Konzentration.

[0272] Ca. 20 nüchterne adulte Katzenflöhe (*Ctenocephalides felis*) werden in eine Kammer eingesetzt, die oben und unten mit Gaze verschlossen ist. Auf die Kammer wird ein Metallzylinder gestellt, dessen Unterseite mit Parafilm verschlossen ist. Der Zylinder enthält die Blut-Wirkstoffzubereitung, die von den Flöhen durch die Parafilmmembran aufgenommen werden kann.

15 [0273] Nach 2 Tagen wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Flöhe abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keiner der Flöhe abgetötet wurde.

[0274] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-3, Ic-4, Ic-6, Ic-7, Ic-8, Ic-11, Ic-12, Ic-13, Ic-16, Ic-18, Ic-19, Ic-20, Ic-21, Ic-22, Ic-23, Ic-24, Ic-27, Ic-28, Ic-29, Ic-31, Ic-32, Ic-33, Ic-34, Ic-35, Ic-36, Ic-37, Ic-38, Ic-39, Ic-40, Ic-41, Ic-42, Ic-43, Ic-44, Ic-45, Ic-46, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-53, Ic-54, Ic-55, Ic-56, Ic-57, Ic-58, Ic-59, Ic-60, Ic-61, Ic-64, Ic-65, Ic-66, Ic-67, Ic-68, Ic-70, Ic-71, Ic-73, Ic-74, Ic-75, Ic-76, Ic-77, Ic-78, Ic-80, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-91, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-97, Ic-99, Ic-103, Ic-106, Ic-136, Ic-137, Ic-139, Ic-140, Ic-147, Ic-149, Ic-150, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-154, Ic-156, Ic-158, Ic-159, Ic-160, Ic-161, Ic-163, Ic-164, Ic-165, Ic-166, Ic-174, Ic-175, Id-1, Id-2, Ie-1

25 [0275] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 98% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-10

[0276] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 95% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-25, Ic-62, Ic-63

30 [0277] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-17, Ic-89, Ic-157

[0278] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-92

35 **E. Lucilia cuprina - Test (LUCICU)**

[0279]

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

40 [0280] Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5 ml Dimethylsulfoxid und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

[0281] Ca. 20 L1-Larven der Australischen Schafgoldfliege (*Lucilia cuprina*) werden in ein Testgefäß überführt, welches gehacktes Pferdefleisch und die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration enthält.

45 [0282] Nach 2 Tagen wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Larven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Larven abgetötet wurden.

[0283] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-3, Ic-4, Ic-6, Ic-7, Ic-8, Ic-10, Ic-11, Ic-12, Ic-13, Ic-14, Ic-16, Ic-17, Ic-18, Ic-19, Ic-20, Ic-21, Ic-22, Ic-23, Ic-24, Ic-25, Ic-27, Ic-28, Ic-29, Ic-32, Ic-33, Ic-34, Ic-35, Ic-36, Ic-37, Ic-38, Ic-39, Ic-40, Ic-41, Ic-42, Ic-43, Ic-44, Ic-45, Ic-46, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-53, Ic-54, Ic-55, Ic-56, Ic-57, Ic-58, Ic-59, Ic-60, Ic-61, Ic-62, Ic-63, Ic-64, Ic-65, Ic-66, Ic-67, Ic-68, Ic-70, Ic-71, Ic-73, Ic-74, Ic-75, Ic-76, Ic-77, Ic-78, Ic-80, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-88, Ic-89, Ic-90, Ic-91, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-97, Ic-103, Ic-106, Ic-136, Ic-137, Ic-140, Ic-147, Ic-149, Ic-150, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-154, Ic-157, Ic-158, Ic-159, Ic-160, Ic-161, Ic-163, Ic-164, Ic-165, Ic-166, Ic-174, Ic-175, Id-1

55 [0284] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 95% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-92, Id-2

[0285] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-31

[0286] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-72, Ic-99

**F. *Musca domestica*-Test (MUSCDO)**

[0287]

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

[0288] Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5 ml Dimethylsulfoxid und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

[0289] Gefäße, die einen Schwamm enthalten, der mit Zuckerlösung und der Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt wurde, werden mit 10 adulten Stubenfliegen (*Musca domestica*) besetzt.

[0290] Nach 2 Tagen wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Fliegen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine der Fliegen abgetötet wurde.

[0291] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ib-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-3, Ic-7, Ic-11, Ic-12, Ic-16, Ic-18, Ic-19, Ic-21, Ic-23, Ic-24, Ic-27, Ic-28, Ic-29, Ic-32, Ic-33, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-38, Ic-39, Ic-40, Ic-41, Ic-43, Ic-45, Ic-46, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-55, Ic-57, Ic-59, Ic-60, Ic-62, Ic-65, Ic-66, Ic-70, Ic-77, Ic-78, Ic-80, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-91, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-97, Ic-106, Ic-147, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-159, Ic-160, Ic-166, Ic-174, Ic-175, Id-1

[0292] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 95% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ic-67

[0293] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ia-2, Ic-6, Ic-25, Ic-73, Ic-136, Ic-140, Ic-154, Ic-158, Ic-163, Ic-164

[0294] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 100ppm: Ia-1, Ic-44, Ic-58, Ic-61, Ic-64, Ic-68, Ic-71, Ic-76, Ic-103, Ic-161

**Biologische Ausführungsbeispiele für Verwendungen im Bereich Pflanzenschutz**

**G. *Myzus persicae* - Sprühtest (MYZUPE)**

[0295]

Lösungsmittel: 78 Gewichtsteile Aceton  
1,5 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: Alkylarylpolyglykolether

[0296] Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung löst man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Gewichtsteilen Lösungsmittel und füllt mit Wasser, welches eine Emulgatorkonzentration von 1000 ppm enthält, bis zum Erreichen der gewünschten Konzentration auf. Zur Herstellung weiterer Testkonzentrationen wird mit emulgatorhaltigem Wasser verdünnt.

[0297] Chinakohlblattscheiben (*Brassica pekinensis*), die von allen Stadien der Grünen Pfirsichblattlaus (*Myzus persicae*) befallen sind, werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gespritzt.

[0298] Nach 6 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

[0299] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 500g/ha: Ic-40, Ic-41, Ic-47, Ic-55, Ic-71, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-90, Ic-91, Ic-94, Ic-97, Ic-139, Ic-141, Ic-147, Ic-151, Ic-152, Ic-159, Ic-181, Ic-188

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 500g/ha: Ic-1, Ic-24, Ic-27, Ic-49, Ic-70, Ic-95, Ic-116, Ic-117, Ic-153, Ic-156, Ic-163, Ic-164, Ic-166, Ic-167, Ic-180, Ic-187

[0300] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100g/ha: Ic-2, Ic-11, Ic-77, Ic-96, Ic-109, Ic-111, Ic-112, Ic-118, Ic-121, Ic-126, Ic-127, Ic-133, Ic-134, Ic-182, Ic-185, Ic-190

[0301] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 90% bei einer

## EP 2 953 942 B1

Aufwandmenge von 100g/ha: lb-2, lc-28, lc-34, lc-36, lc-48, lc-65, lc-66, lc-78, lc-79, lc-80, lc-81, lc-87, lc-108, lc-113, lc-115, lc-122, lc-129, lc-132, lc-147, lc-186

### H. Phaedon cochleariae - Sprühtest (PHAECO)

#### [0302]

Lösungsmittel: 78,0 Gewichtsteile Aceton  
1,5 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: Alkylarylpolyglykolether

[0303] Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung löst man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Gewichtsteilen Lösungsmittel und füllt mit Wasser, welches eine Emulgatorkonzentration von 1000 ppm enthält, bis zum Erreichen der gewünschten Konzentration auf. Zur Herstellung weiterer Testkonzentrationen wird mit emulgatorhaltigem Wasser verdünnt.

[0304] Chinakohlblattscheiben (*Brassica pekinensis*) werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gespritzt und nach dem Abtrocknen mit Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*) besetzt.

[0305] Nach 7 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

[0306] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 500g/ha: lc-1, lc-24, lc-27, lc-33, lc-38, lc-39, lc-40, lc-41, lc-42, lc-43, lc-44, lc-45, lc-46, lc-47, lc-48, lc-49, lc-51, lc-52, lc-54, lc-55, lc-56, lc-58, lc-59, lc-60, lc-61, lc-62, lc-63, lc-64, lc-70, lc-71, lc-72, lc-73, lc-74, lc-75, lc-76, lc-84, lc-85, lc-86, lc-87, lc-88, lc-89, lc-90, lc-91, lc-92, lc-93, lc-94, lc-95, lc-97, lc-105, lc-106, lc-107, lc-116, lc-117, lc-136, lc-139, lc-140, lc-141, lc-142, lc-147, lc-149, lc-150, lc-151, lc-152, lc-153, lc-154, lc-156, lc-157, lc-159, lc-161, lc-163, lc-164, lc-165, lc-166, lc-167, lc-171, lc-173, lc-174, lc-175, lc-176, lc-179, lc-180, lc-181, lc-183, lc-184, lc-186, lc-187, lc-188, lc-193, lc-198, lc-200

[0307] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 83% bei einer Aufwandmenge von 500g/ha: lc-69, lc-137

[0308] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100g/ha: la-1, la-2, lb-2, lb-3, lc-2, lc-3, lc-6, lc-7, lc-10, lc-11, lc-12, lc-13, lc-14, lc-15, lc-16, lc-17, lc-18, lc-19, lc-20, lc-21, lc-22, lc-23, lc-25, lc-28, lc-29, lc-30, lc-31, lc-32, lc-34, lc-35, lc-36, lc-37, lc-53, lc-65, lc-66, lc-67, lc-68, lc-78, lc-79, lc-80, lc-81, lc-83, lc-96, lc-99, lc-103, lc-104, lc-108, lc-109, lc-110, lc-111, lc-113, lc-115, lc-118, lc-119, lc-121, lc-122, lc-124, lc-125, lc-126, lc-127, lc-128, lc-129, lc-130, lc-131, lc-132, lc-133, lc-134, lc-168, lc-169, lc-170, lc-177, lc-178, lc-182, lc-185, lc-189, lc-190, lc-191, lc-192, ld-1, ld-2, le-1, le-4, le-5

[0309] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 83% bei einer Aufwandmenge von 100g/ha: lb-1, lc-5, lc-57, lc-120, lc-135

### I. Spodoptera frugiperda - Sprühtest (SPODFR)

#### [0310]

Lösungsmittel: 78,0 Gewichtsteile Aceton  
1,5 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: Alkylarylpolyglykolether

[0311] Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung löst man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Gewichtsteilen Lösungsmittel und füllt mit Wasser, welches eine Emulgatorkonzentration von 1000 ppm enthält, bis zum Erreichen der gewünschten Konzentration auf. Zur Herstellung weiterer Testkonzentrationen wird mit emulgatorhaltigem Wasser verdünnt.

[0312] Maisblattscheiben (*Zea mays*) werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gespritzt und nach dem Abtrocknen mit Raupen des Heerwurms (*Spodoptera frugiperda*) besetzt.

[0313] Nach 7 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupe abgetötet wurde.

[0314] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 100% bei

## EP 2 953 942 B1

einer Aufwandmenge von 500g/ha: Ic-1, Ic-24, Ic-27, Ic-38, Ic-39, Ic-40, Ic-41, Ic-43, Ic-44, Ic-45, Ic-46, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-55, Ic-59, Ic-60, Ic-62, Ic-70, Ic-71, Ic-73, Ic-74, Ic-75, Ic-76, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-91, Ic-94, Ic-95, Ic-97, Ic-105, Ic-107, Ic-116, Ic-117, Ic-136, Ic-139, Ic-140, Ic-141, Ic-142, Ic-147, Ic-149, Ic-150, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-154, Ic-156, Ic-157, Ic-159, Ic-161, Ic-163, Ic-164, Ic-165, Ic-166, Ic-167, Ic-171, Ic-174, Ic-175, Ic-176, Ic-180, Ic-181, Ic-183, Ic-184, Ic-186, Ic-187, Ic-188, Ic-193, Ic-198, Ic-200

**[0315]** Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 83% bei einer Aufwandmenge von 500g/ha: Ic-33, Ic-42, Ic-89, Ic-106

**[0316]** Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100g/ha: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ib-3, Ic-2, Ic-3, Ic-6, Ic-7, Ic-10, Ic-11, Ic-12, Ic-13, Ic-14, Ic-16, Ic-17, Ic-18, Ic-19, Ic-20, Ic-21, Ic-22, Ic-23, Ic-25, Ic-28, Ic-29, Ic-32, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-39, Ic-61, Ic-64, Ic-66, Ic-73, Ic-77, Ic-78, Ic-79, Ic-80, Ic-81, Ic-83, Ic-96, Ic-103, Ic-109, Ic-110, Ic-111, Ic-112, Ic-113, Ic-115, Ic-118, Ic-122, Ic-124, Ic-126, Ic-127, Ic-128, Ic-129, Ic-131, Ic-132, Ic-133, Ic-135, Ic-169, Ic-170, Ic-177, Ic-182, Ic-185, Ic-190, Id-1, Id-2

**[0317]** Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 83% bei einer Aufwandmenge von 100g/ha: Ic-68, Ic-65, Ic-108, Ic-119, Ic-125, Ic-168

### J. Tetranychus urticae - Sprühtest, OP-resistent (TETRUR)

#### **[0318]**

Lösungsmittel: 78,0 Gewichtsteile Aceton  
1,5 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator : Alkylarylpolyglykoether

**[0319]** Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung löst man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Gewichtsteilen Lösungsmittel und füllt mit Wasser, welches eine Emulgatorkonzentration von 1000 ppm enthält, bis zum Erreichen der gewünschten Konzentration auf. Zur Herstellung weiterer Testkonzentrationen wird mit emulgatorhaltigem Wasser verdünnt.

**[0320]** Bohnenblattscheiben (*Phaseolus vulgaris*), die von allen Stadien der Gemeinen Spinnmilbe (*Tetranychus urticae*) befallen sind, werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gesprüht.

**[0321]** Nach 6 Tagen wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Spinnmilben abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Spinnmilben abgetötet wurden.

**[0322]** Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 500g/ha: Ic-1, Ic-24, Ic-27, Ic-40, Ic-41, Ic-71, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-91, Ic-94, Ic-95, Ic-97, Ic-107, Ic-116, Ic-117, Ic-136, Ic-137, Ic-139, Ic-140, Ic-141, Ic-142, Ic-147, Ic-149, Ic-150, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-154, Ic-156, Ic-157, Ic-159, Ic-161, Ic-163, Ic-164, Ic-165, Ic-166, Ic-167, Ic-175, Ic-176, Ic-180, Ic-181, Ic-183, Ic-184, Ic-187, Ic-188, Ic-193, Ic-198, Ic-200 Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 500g/ha: Ic-49, Ic-69, Ic-90, Ic-105, Ic-171, Ic-186

**[0323]** Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 500g/ha: Ic-44, Ic-55, Ic-76

**[0324]** Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 100g/ha: Ia-1, Ib-2, Ib-3, Ic-2, Ic-10, Ic-17, Ic-19, Ic-20, Ic-21, Ic-22, Ic-23, Ic-28, Ic-32, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-39, Ic-63, Ic-64, Ic-65, Ic-66, Ic-67, Ic-68, Ic-73, Ic-77, Ic-78, Ic-79, Ic-80, Ic-81, Ic-83, Ic-96, Ic-99, Ic-103, Ic-104, Ic-108, Ic-109, Ic-110, Ic-111, Ic-112, Ic-113, Ic-115, Ic-118, Ic-119, Ic-120, Ic-121, Ic-122, Ic-123, Ic-124, Ic-125, Ic-126, Ic-127, Ic-128, Ic-129, Ic-131, Ic-132, Ic-133, Ic-134, Ic-135, Ic-168, Ic-169, Ic-170, Ic-177, Ic-185, Ic-189, Ic-190

**[0325]** Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 100g/ha: Ia-2, Ic-3, Ic-9, Ic-11, Ic-13, Ic-48, Ic-56, Ic-59, Ic-182

### K. Meloidogyne incognita- Test (MELGIN)

#### **[0326]**

Lösungsmittel: 125,0 Gewichtsteile Aceton

**[0327]** Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der an-

gegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

[0328] Gefäße werden mit Sand, Wirkstofflösung, einer Ei-Larven-Suspension des südlichen Wurzelgallenälchens (*Meloidogyne incognita*) und Salatsamen gefüllt. Die Salatsamen keimen und die Pflänzchen entwickeln sich. An den Wurzeln entwickeln sich die Gallen.

[0329] Nach 14 Tagen wird die nematizide Wirkung anhand der Gallenbildung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass keine Gallen gefunden wurden; 0 % bedeutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der unbehandelten Kontrolle entspricht.

[0330] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 20ppm: Ic-152

[0331] Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele Wirkung von 90% bei einer Aufwandmenge von 20ppm: Ic-1, Ic-26, Ic-120, Ic-156

## Biologische Ausführungsbeispiele für Verwendungen im Bereich Tiergesundheit II:

### T1. Ctenocephalides felis - in-vitro Kontakttests mit adulten Katzenflöhen

[0332] Für die Beschichtung der Teströhrchen werden zunächst 9 mg Wirkstoff in 1 ml Aceton p.a. gelöst und anschließend mit Aceton p.a. auf die gewünschte Konzentration verdünnt. 250 µl der Lösung werden durch Drehen und Kippen auf einem Rotationsschüttler (2 h Schaukelrotation bei 30 rpm) homogen auf den Innenwänden und dem Boden eines 25ml Glasröhrchens verteilt. Bei 900 ppm Wirkstofflösung und 44,7 cm<sup>2</sup> Innenoberfläche wird bei homogener Verteilung eine Flächendosis von 5 µg/cm<sup>2</sup> erreicht.

[0333] Nach Abdampfen des Lösungsmittels werden die Gläschen mit 5-10 adulten Katzenflöhen (*Ctenocephalides felis*) besetzt, mit einem gelochten Kunststoffdeckel verschlossen und liegend bei Raumtemperatur und Umgebungsfeuchte inkubiert. Nach 48 h wird die Wirksamkeit bestimmt. Hierzu werden die Gläschen aufrecht gestellt und die Flöhe auf den Boden des Gläschens geklopft. Flöhe die unbeweglich auf dem Boden verbleiben oder sich unkoordiniert bewegen gelten als tot bzw. angeschlagen.

[0334] Eine Substanz zeigt gute Wirkung gegen *Ctenocephalides felis*, wenn in diesem Test bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup> mindestens 80% Wirkung erzielt wurde. Dabei bedeutet 100% Wirkung, dass alle Flöhe angeschlagen oder tot waren. 0% Wirkung bedeutet, dass keine Flöhe geschädigt wurden.

[0335] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup>: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-11, Ic-12, Ic-16, Ic-18, Ic-19, Ic-21, Ic-23, Ic-24, Ic-27, Ic-28, Ic-29, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-41, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-65, Ic-66, Ic-68, Ic-70, Ic-71, Ic-77, Ic-78, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-91, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-97, Ic-107, Ic-108, Ic-109, Ic-110, Ic-111, Ic-112, Ic-113, Ic-118, Ic-139, Ic-140, Ic-141, Ic-142, Ic-143, Ic-144, Ic-145, Ic-147, Ic-148, Ic-149, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-155, Ic-158, Ic-159, Ic-160, Ic-163, Ic-164, Ic-165, Ic-166, Ic-167, Ic-175, Ic-199, Ic-211

[0336] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup>: Ic-32, Ic-138, Ic-146, Ic-154

[0337] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 1 µg/cm<sup>2</sup>: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-11, Ic-12, Ic-16, Ic-18, Ic-19, Ic-21, Ic-23, Ic-24, Ic-27, Ic-28, Ic-29, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-41, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-65, Ic-66, Ic-70, Ic-71, Ic-77, Ic-78, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-91, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-97, Ic-107, Ic-108, Ic-109, Ic-111, Ic-112, Ic-113, Ic-118, Ic-139, Ic-140, Ic-141, Ic-142, Ic-143, Ic-144, Ic-145, Ic-147, Ic-151, Ic-152, Ic-153, Ic-154, Ic-155, Ic-158, Ic-159, Ic-160, Ic-163, Ic-163, Ic-164, Ic-165, Ic-166, Ic-167, Ic-175, Ic-199, Ic-211

[0338] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 1 µg/cm<sup>2</sup>: Ic-146, Ic-149

### T2. Rhipicephalus sanguineus - in-vitro Kontakttests mit Adulten der braunen Hundezecke

[0339] Für die Beschichtung der Teströhrchen werden zunächst 9 mg Wirkstoff in 1 ml Aceton p.a. gelöst und anschließend mit Aceton p.a. auf die gewünschte Konzentration verdünnt. 250 µl der Lösung werden durch Drehen und Kippen auf einem Rotationsschüttler (2 h Schaukelrotation bei 30 rpm) homogen auf den Innenwänden und dem Boden eines 25ml Glasröhrchens verteilt. Bei 900 ppm Wirkstofflösung und 44,7 cm<sup>2</sup> Innenoberfläche wird bei homogener Verteilung eine Flächendosis von 5 µg/cm<sup>2</sup> erreicht.

[0340] Nach Abdampfen des Lösungsmittels werden die Gläschen mit 5-10 adulten Hundezecken (*Rhipicephalus sanguineus*) besetzt, mit einem gelochten Kunststoffdeckel verschlossen und liegend im Dunkeln bei Raumtemperatur und Umgebungsfeuchte inkubiert. Nach 48 h wird die Wirksamkeit bestimmt. Hierzu werden die Zecken auf den Boden des Gläschens geklopft und auf einer Wärmeplatte bei 45-50°C maximal 5 min. inkubiert. Zecken, die unbeweglich auf dem Boden verbleiben oder sich so unkoordiniert bewegen, dass sie nicht gezielt der Wärme durch nach oben klettern

ausweichen können, gelten als tot bzw. angeschlagen.

[0341] Eine Substanz zeigt gute Wirkung gegen *Rhipicephalus sanguineus*, wenn in diesem Test bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup> mindestens 80% Wirkung erzielt wurde. Dabei bedeutet 100% Wirkung, dass alle Zecken angeschlagen oder tot waren. 0% Wirkung bedeutet, dass keine Zecken geschädigt wurden.

[0342] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup>: Ia-1, Ia-2, Ic-1, Ic-2, Ic-11, Ic-16, Ic-18, Ic-21, Ic-23, Ic-24, Ic-25, Ic-27, Ic-28, Ic-34, Ic-36, Ic-37, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-54, Ic-66, Ic-70, Ic-71, Ic-77, Ic-78, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-103, Ic-106, Ic-109, Ic-111, Ic-112, Ic-113, Ic-141, Ic-142, Ic-143, Ic-151, Ic-152, Ic-155, Ic-160, Ic-161, Ic-164, Ic-166, Ic-167, Ic-174, Ic-201

[0343] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup>: Ib-3, Ic-19, Ic-61, Ic-73, Ic-91, Ic-108, Ic-153

[0344] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 1 µg/cm<sup>2</sup>: Ia-1, Ia-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-11, Ic-16, Ic-18, Ic-19, Ic-21, Ic-23, Ic-24, Ic-25, Ic-27, Ic-36, Ic-37, Ic-43, Ic-46, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-54, Ic-59, Ic-66, Ic-68, Ic-70, Ic-77, Ic-78, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-85, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-94, Ic-95, Ic-96, Ic-103, Ic-109, Ic-111, Ic-112, Ic-143, Ic-151, Ic-152, Ic-155, Ic-160, Ic-163, Ic-164, Ic-166, Ic-167, Ic-174, Ic-201

[0345] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 1 µg/cm<sup>2</sup>: Ic-32, Ic-34, Ic-67, Ic-71, Ic-73, Ic-113, Ic-141, Ic-142, Ic-147, Ic-148, Ic-153, Ic-161

### T3. Ixodes ricinus - in-vitro Kontakttests mit Adulten des Gemeinen Holzbocks

[0346] Für die Beschichtung der Teströhrchen werden zunächst 9 mg Wirkstoff in 1 ml Aceton p.a. gelöst und anschließend mit Aceton p.a. auf die gewünschte Konzentration verdünnt. 250 µl der Lösung werden durch Drehen und Kippen auf einem Rotationsschüttler (2 h Schaukelrotation bei 30 rpm) homogen auf den Innenwänden und dem Boden eines 25ml Glasröhrchens verteilt. Bei 900 ppm Wirkstofflösung und 44,7 cm<sup>2</sup> Innenoberfläche wird bei homogener Verteilung eine Flächendosis von 5 µg/cm<sup>2</sup> erreicht.

[0347] Nach Abdampfen des Lösungsmittels werden die Gläschen mit 5-10 Adulten des Gemeinen Holzbocks (*Ixodes ricinus*) besetzt, mit einem gelochten Kunststoffdeckel verschlossen und liegend im Dunkeln bei 22°C und 90% rel. Feuchte im Klimaschrank inkubiert. Nach 48 h wird die Wirksamkeit bestimmt. Hierzu werden die Zecken auf den Boden des Gläschens geklopft und auf einer Wärmeplatte bei 45-50°C maximal 5 min. inkubiert. Zecken, die unbeweglich auf dem Boden verbleiben oder sich so unkoordiniert bewegen, dass sie nicht gezielt der Wärme durch nach oben klettern ausweichen können, gelten als tot bzw. angeschlagen.

[0348] Eine Substanz zeigt gute Wirkung gegen *Ixodes ricinus*, wenn in diesem Test bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup> 80% Wirkung erzielt wurde. Dabei bedeutet 100% Wirkung, dass alle Zecken angeschlagen oder tot waren. 0% Wirkung bedeutet, dass keine Zecken geschädigt wurden.

[0349] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup>: Ia-1, Ia-2, Ic-1, Ic-2, Ic-11, Ic-16, Ic-21, Ic-23, Ic-37, Ic-47, Ic-48, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-94

[0350] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup>: Ib-3, Ic-18

[0351] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 1 µg/cm<sup>2</sup>: Ia-1, Ia-2, Ic-1, Ic-2, Ic-16, Ic-23, Ic-37, Ic-81, Ic-84, Ic-90, Ic-94

[0352] Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 1 µg/cm<sup>2</sup>: Ib-3, Ic-11, Ic-21, Ic-48, Ic-86, Ic-87

### T4. Amblyomma hebraeum - in-vitro Kontakttests mit Nymphen der Bunten Zecke

[0353] Für die Beschichtung der Teströhrchen werden zunächst 9 mg Wirkstoff in 1 ml Aceton p.a. gelöst und anschließend mit Aceton p.a. auf die gewünschte Konzentration verdünnt. 250 µl der Lösung werden durch Drehen und Kippen auf einem Rotationsschüttler (2 h Schaukelrotation bei 30 rpm) homogen auf den Innenwänden und dem Boden eines 25ml Glasröhrchens verteilt. Bei 900 ppm Wirkstofflösung und 44,7 cm<sup>2</sup> Innenoberfläche wird bei homogener Verteilung eine Flächendosis von 5 µg/cm<sup>2</sup> erreicht.

[0354] Nach Abdampfen des Lösungsmittels werden die Gläschen mit 5-10 Nymphen der Bunten Zecke (*Amblyomma hebraeum*) besetzt, mit einem gelochten Kunststoffdeckel verschlossen und liegend im Dunkeln bei 27°C und 85% rel. Feuchte im Klimaschrank inkubiert. Nach 48 h wird die Wirksamkeit bestimmt. Hierzu werden die Zecken auf den Boden des Gläschens geklopft und auf einer Wärmeplatte bei 45-50°C maximal 5 min inkubiert. Zecken, die unbeweglich auf dem Boden verbleiben oder sich so unkoordiniert bewegen, dass sie nicht gezielt der Wärme durch nach oben klettern ausweichen können, gelten als tot bzw. angeschlagen.

**[0355]** Eine Substanz zeigt gute Wirkung gegen *Amblyomma hebraeum*- Nymphen, wenn in diesem Test bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup> mindestens 80% Wirkung erzielt wurde. Dabei bedeutet 100% Wirkung, dass alle Zecken angeschlagen oder tot waren. 0% Wirkung bedeutet, dass keine Zecken geschädigt wurden.

**[0356]** Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 5 µg/cm<sup>2</sup>: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ib-3, Ic-1, Ic-2, Ic-3, Ic-11, Ic-16, Ic-18, Ic-19, Ic-21, Ic-23, Ic-32, Ic-37, Ic-47, Ic-48, Ic-49, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-94, Ic-95

**[0357]** Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 100% bei einer Aufwandmenge von 1 µg/cm<sup>2</sup>: Ia-1, Ia-2, Ib-2, Ic-1, Ic-2, Ic-11, Ic-16, Ic-18, Ic-19, Ic-21, Ic-23, Ic-32, Ic-37, Ic-47, Ic-48, Ic-81, Ic-83, Ic-84, Ic-86, Ic-87, Ic-90, Ic-94, Ic-95

**[0358]** Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 1 µg/cm<sup>2</sup>: Ib-3, Ic-3

#### **T6. Dermacentor variabilis - Systemische Wirksamkeit in-vivo gegen Nymphen der Amerikanischen Hundezecke an Ratten**

**[0359]** In einer randomisierten nicht-verblindeten Placebo-kontrollierten Studie wird die Wirksamkeit von Herstellungsbeispielen der erfindungsgemäßen Halogen-substituierten-Verbindungen der Formel (I) gegen Nymphen der amerikanischen Hundezecke (*Dermacentor variabilis*) auf Ratten (*Rattus norvegicus*; Stamm: Whistar Unilever, HsdCpb:WU) nach intraperitonealer Behandlung überprüft. Hierzu wird eine geeignete Menge des Wirkstoffes in Glycerolformal gelöst und intraperitoneal injiziert. Das applizierte Volumen liegt je nach Wirkstoffkonzentration zwischen 30 und 90 µl/100 g Körpergewicht. Es werden 5 Ratten pro Gruppe verwendet, die Ergebnisse werden als arithmetische Mittel berichtet. Vor der Zeckeninfestationen werden alle Ratten mit Halskragen versehen. Für die Zeckeninfestation und das Auszählen werden die Ratten mit 30-50 µl Medetomidinehydrochlorid (e.g. Domitor®) s.c./Ratte sediert. Alle Ratten werden an Tag 0 (min. 1 h nach Behandlung), Tag 7, Tag 14 etc. mit 30 nüchternen Nymphen von *Dermacentor variabilis* infestiert. An Tag 2, Tag 9, Tag 16 etc. wird der Halskragen entfernt und der gesamte Körper der sedierten Ratten systematisch nach Zecken abgesucht. Zecken werden mit einer Pinzette entfernt und durch zerdrücken auf Fließpapier auf gesaugtes Blut untersucht.

**[0360]** Die Wirksamkeit der Behandlung wird über den Vergleich einer Placebo-behandelten Kontrollgruppe ermittelt. Eine Verbindung gilt als hochwirksam, wenn sie bei einer Dosierung von 10 mg/kg an Tag 2 nach intraperitonealer Behandlung eine Wirksamkeit von 90% gegen Nymphen der Amerikanischen Hundezecke (*Dermacentor variabilis*) zeigt. Eine länger andauernde Wirkung gilt als gegeben, wenn an Tag 9 noch eine Wirksamkeit von mehr als 80% Wirkung gegeben ist.

**[0361]** Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele bei 10 mg/kg Anwendungsdosierung eine Wirkung von >90% gegen Zeckennymphen an Tag 2: Ic-1, Ic-2

**[0362]** Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele bei 10 mg/kg Anwendungsdosierung eine Wirkung von >80% gegen Zeckennymphen an Tag 9: Ic-1, Ic-2

#### **T7. Ctenocephalides felis - Systemische Wirksamkeit in-vivo gegen Flöhe an Ratten**

**[0363]** In einer randomisierten nicht-verblindeten Placebo-kontrollierten Studie wird die Wirksamkeit von Herstellungsbeispielen der erfindungsgemäßen Halogen-substituierten-Verbindungen der Formel (I) gegen Adulte des Katzenfloh (*Ctenocephalides felis*) auf Ratten (*Rattus norvegicus*; Stamm: Whistar Unilever, HsdCpb:WU) nach intraperitonealer Behandlung überprüft. Hierzu wird eine geeignete Menge des Wirkstoffes in Glycerolformal gelöst und intraperitoneal injiziert. Das applizierte Volumen liegt je nach Wirkstoffkonzentration zwischen 30 und 90 µl/100 g Körpergewicht. Es werden 5 Ratten pro Gruppe verwendet, die Ergebnisse werden als arithmetische Mittel berichtet. Vor der Flohinfestationen werden alle Ratten mit Halskragen versehen. Für die Flohinfestation und das Auszählen werden die Ratten mit 30-50 µl Medetomidinehydrochlorid (e.g. Domitor®) s.c./Ratte sediert. Alle Ratten werden an Tag 0 (ab ca. 1 h nach Behandlung), Tag 7, Tag 14 etc. mit 30 nüchternen Adulten von *Ctenocephalides felis* infestiert. An Tag 2, Tag 9, Tag 16 etc wird der Halskragen entfernt und der gesamte Körper der sedierten Ratten systematisch mit einem Flohkamm nach Flöhen durchkämmt. Die Flöhe werden gezählt und entfernt.

**[0364]** Die Wirksamkeit der Behandlung wird über den Vergleich einer Placebo-behandelten Kontrollgruppe ermittelt. Eine Verbindung gilt als hochwirksam, wenn sie bei einer Dosierung von 10 mg/kg an Tag 2 nach intraperitonealer Behandlung eine Wirksamkeit von 95% gegen Adulte Flöhe (*Ctenocephalides felis*) zeigt. Eine länger andauernde Wirkung gilt als gegeben, wenn an Tag 9 noch eine Wirksamkeit von mehr als 90% Wirkung gegeben ist.

**[0365]** Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele bei 10 mg/kg Anwendungsdosierung eine Wirkung von >95% gegen Flöhe an Tag 2: Ic-1, Ic-2

**[0366]** Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele bei 10 mg/kg Anwendungsdosierung eine Wirkung von >90% gegen Flöhe an Tag 9: Ic-1, Ic-2

**T8. Haemonchus contortus - Test (HAEMCO)****[0367]**

5

Lösungsmittel: Dimethylsulfoxid

**[0368]** Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 10 mg Wirkstoff mit 0,5 ml Dimethylsulfoxid und verdünnt das Konzentrat mit "Ringerlösung" auf die gewünschte Konzentration.

10 **[0369]** Gefäße mit der Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration werden mit ca. 40 Larven des Roten Magenwurmes (*Haemonchus contortus*) besetzt.

**[0370]** Nach 5 Tagen wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Larven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine der Larven abgetötet wurde.

15 **[0371]** Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele eine Wirkung von 80% bei einer Aufwandmenge von 20ppm: Ic-1, Ic-16

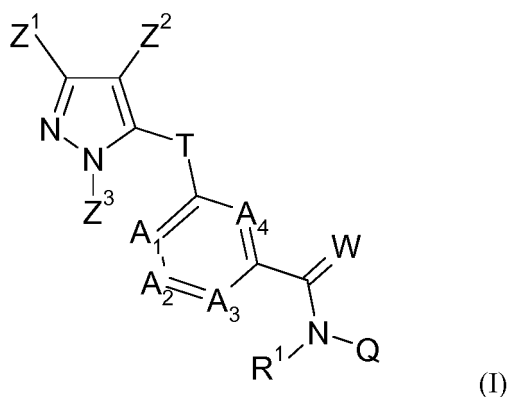
**Patentansprüche**

20

1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I),

25

30



35

in denen

40

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls ein- oder mehrfach unabhängig voneinander mit Halogen, Cyano, Alkoxy und Alkoxy-carbonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, Heteroaryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, die chemischen Gruppierungen

A<sub>1</sub> für CR<sup>2</sup> oder Stickstoff,

A<sub>2</sub> für CR<sup>3</sup> oder Stickstoff,

A<sub>3</sub> für CR<sup>4</sup> oder Stickstoff, und

45

A<sub>4</sub> für CR<sup>5</sup> oder Stickstoff stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A<sub>1</sub> bis A<sub>4</sub> gleichzeitig für Stickstoff stehen;

50

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-imino-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino oder N,N-Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino stehen;

W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

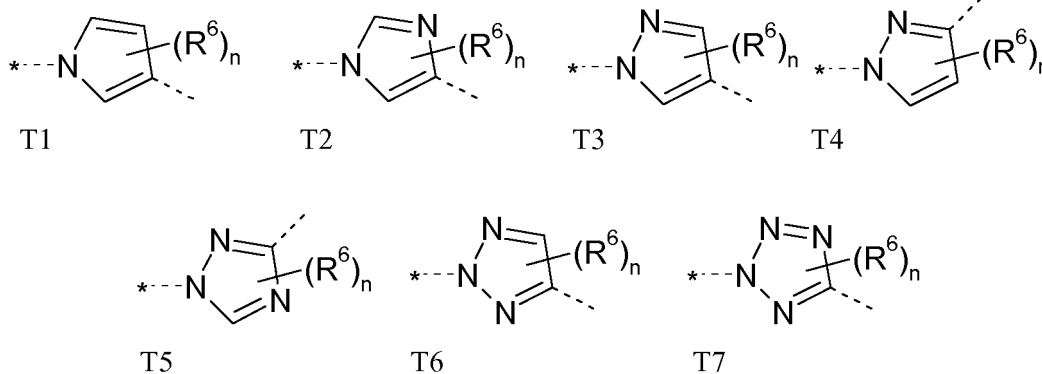
55

Q für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl oder eine der gegebenenfalls unabhängig von einander ein- oder mehrfach mit Hydroxy, Nitro, Amino, Halogen, Alkoxy, Cyano, Hydroxycarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkyl-carbamoyl, Cycloalkyl-carbamoyl, Phenyl substituierten Gruppierungen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Heterocycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, Aryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, Heteroaryl(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-carbonylamino oder N,N-Di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino steht; oder

Q für ein mit 0 - 4 Substituenten V substituierten Aryl oder für ein mit 0 - 4 Substituenten V substituierten 5 bzw. 6 gliedrigen Heteroaromaten steht, wobei

V unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Nitro, gegebenenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-imino-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, N,N-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino steht;

T für einen der nachfolgend aufgeführten 5 gliedrigen Heteroaromaten T1-T7 steht, wobei die Bindung zur Pyrazolkopfgruppe mit einem Sternchen gekennzeichnet ist,



wobei

R<sup>6</sup> unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Nitro, Amino oder ein gegebenenfalls mit Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, und n für die Werte 0-1 stehen;

Z<sup>1</sup> für ein gegebenenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, und

Z<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Amino oder ein gegebenenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfanyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, und

Z<sup>3</sup> für Wasserstoff oder ein gegebenenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, Aryl und Hetaryl stehen.

## 2. Verbindungen, gemäß Anspruch 1, in denen

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl, t-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, s-Butylcarbonyl, t-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, s-Butoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Benzyl, 4-Methoxybenzyl, Pyrid-2-yl-methyl, Pyrid-3-yl-methyl, Pyrid-4-yl-methyl, 4-Chlor-pyrid-3-yl-methyl steht; die chemischen Gruppierungen

A<sub>1</sub> für CR<sup>2</sup> oder Stickstoff,

A<sub>2</sub> für CR<sup>3</sup> oder Stickstoff,

A<sub>3</sub> für CR<sup>4</sup> oder Stickstoff, und

A<sub>4</sub> für CR<sup>5</sup> oder Stickstoff stehen,

wobei aber nicht mehr als drei der chemischen Gruppierungen A<sub>1</sub> bis A<sub>4</sub> gleichzeitig für Stickstoff stehen;

R<sup>2</sup> und R<sup>5</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Fluor und Chlor stehen und

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Chlordifluormethyl, Trifluormethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlor-difluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, N-Methoxyiminomethyl, 1-(N-Methoxyimino)-ethyl, Methylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl stehen;

W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

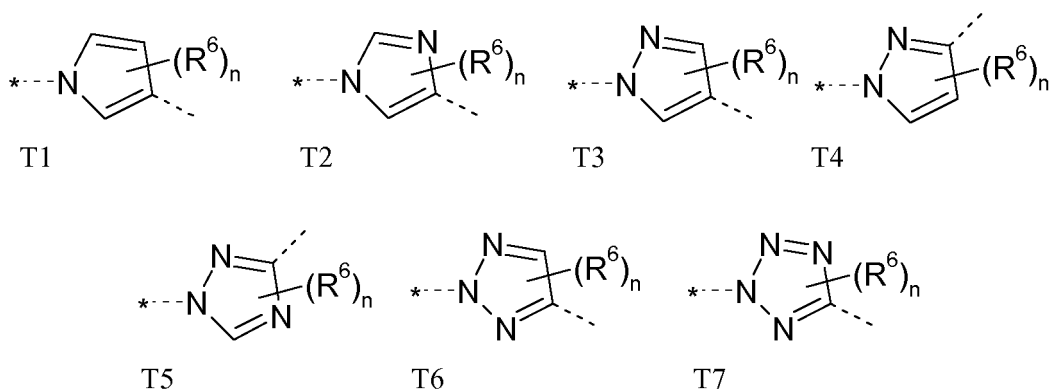
Q für für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, 1,1-Dimethylethyl, 1-Methylpropyl, n-Butyl, 2-Methylpropyl, 2-Methylbutyl, Hydroxyethyl, 2-Hydroxypropyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-

Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-Trifluormethylethyl, 2,2-Difluorpropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 2,2-Dimethyl-3-fluorpropyl, Cyclopropyl, 1-Cyano-cyclopropyl, 1-Methoxycarbonyl-cyclopropyl, 1-(*N*-Methylcarbamoyl)cyclopropyl, 1-(*N*-Cyclopropylcarbamoyl)-cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, 1-Cyclopropylethyl, Bis(cyclopropyl)methyl, 2,2-Dimethylcyclopropyl-methyl, 2-Phenylcyclopropyl, 2,2-Dichlorcyclopropyl, trans-2-Chlorcyclopropyl, cis-2-Chlorcyclopropyl, 2,2-Difluorcyclopropyl, trans-2-Fluorcyclopropyl, cis-2-Fluorcyclopropyl, trans-4-Hydroxycyclohexyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl, Prop-2-enyl, 2-Methylprop-2-enyl, Prop-2-inyl, 1,1-Dimethylbut-2-inyl, 3-Chlor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-1,1-dimethylprop-2-enyl, Phenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, Oxetan-3-yl, Thietan-3-yl, 1-Oxido-thietan-3-yl, 1,1-Dioxido-thietan-3-yl, Isoxazol-3-ylmethyl, 1,2,4-Triazol-3-ylmethyl, 3-Methyloxetan-3-ylmethyl, Benzyl, 2,6-Difluorphenylmethyl, 3-Fluorphenylmethyl, 2-Fluorphenylmethyl, 2,5-Difluorphenylmethyl, 1-Phenylethyl, 4-Chlorphenylethyl, 2-Trifluormethylphenylethyl, 1-Pyridin-2-ylethyl, Pyridin-2-ylmethyl, 5-Fluorpyridin-2-ylmethyl, (6-Chlor-pyridin-3-yl)methyl, Pyrimidin-2-ylmethyl, Methoxy, 2-Ethoxyethyl, 2-(Methylsulfanyl)ethyl, 1-Methyl-2-(ethylsulfanyl)ethyl, 2-Methyl-1-(methylsulfanyl)propan-2-yl, Methoxycarbonyl, Methoxycarbonylmethyl, NH<sub>2</sub>, *N*-Ethylamino, *N*-Allylamino, *N,N*-Dimethylamino, *N,N*-Diethylamino steht; oder

Q für ein mit 0 - 4 Substituenten V substituiertes Phenyl, Naphthyl, Pyridazin, Pyrazin, Pyrimidin, Triazin, Pyridin, Pyrazol, Thiazol, Isothiazol, Oxazol, Isoxazol, Triazol, Imidazol, Furan, Thiophen, Pyrrol, Oxadiazol, Thiadiazol steht, wobei

V unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl, Pentafluor-tert-butyl, Heptafluor-*n*-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-*n*-butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxy, Ethoxy, *n*-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, *N*-Methoxyiminomethyl, 1-(*N*-Methoxyimino)-ethyl, Methylsulfanyl, Methylsulfonyl, Methylsulfanyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfanyl, *N,N*-Dimethylamino steht;

T für einen der nachfolgend aufgeführten 5 gliedrigen Heteroaromaten T1-T7 steht, wobei die Bindung zur Pyrazolkopfgruppe mit einem Sternchen gekennzeichnet ist,



wobei

R<sup>6</sup> unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Methyl, Ethyl, 1-Methylethyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, Trifluormethylcarbonyl, Methylsulfanyl, Methylsulfanyl, Methylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, und n für die Werte 0-1 stehen;

Z<sup>1</sup> für Methyl, Ethyl, 1,1-Dimethylethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Bromdichlormethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl, Pentafluor-*t*-butyl, Heptafluor-*n*-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-*n*-butyl, Cyclopropyl, 1-Chlorcyclopropyl, 1-Fluorcyclopropyl, 1-Bromcyclopropyl, 1-Cyan-cyclopropyl, 1-Trifluormethyl-cyclopropyl, Cyclobutyl und 2,2-Difluor-1-methyl-cyclopropyl, und

Z<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Methyl, Ethyl, 1,1-Dimethylethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, Bromdichlormethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl,

2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl, Pentafluor-t-butyl, Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylthio, Ethylsulfanyl, Ethylsulfonyl, Trifluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlor-difluormethylsulfanyl, Chlordifluormethylsulfinyl, Chlor-difluormethylsulfonyl, Dichlor-fluormethylsulfanyl, Dichlor-fluormethylsulfinyl, Dichlor-fluormethylsulfonyl und

Z<sup>3</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl, t-Butyl, Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Propinyl, 1-Butinyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, 1-Fluorethyl, 1-Fluor-1-methylethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Phenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, 2,5-Dichlorphenyl, 3,4-Dichlorphenyl, 2,6-Dichlorphenyl, 2,6-Dichlor-4-trifluormethylphenyl, 3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl stehen.

### 3. Verbindungen gemäß Anspruch 1 oder 2, in denen

Z<sup>1</sup> für Trifluormethyl, 1-Chlor-cyclopropyl, 1-Fluor-cyclopropyl oder Pentafluorethyl steht,

Z<sup>2</sup> für Trifluormethyl, Nitro, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Fluor, Chlor, Brom, Cyano oder Iod steht,

Z<sup>3</sup> für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder Wasserstoff steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, Isopropylcarbonyl, s-Butylcarbonyl, t-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, s-Butoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, Benzyl, 4-Methoxybenzyl, Pyrid-2-yl-methyl, Pyrid-3-yl-methyl, Pyrid-4-yl-methyl, 4-Chlor-pyrid-3-yl-methyl steht,

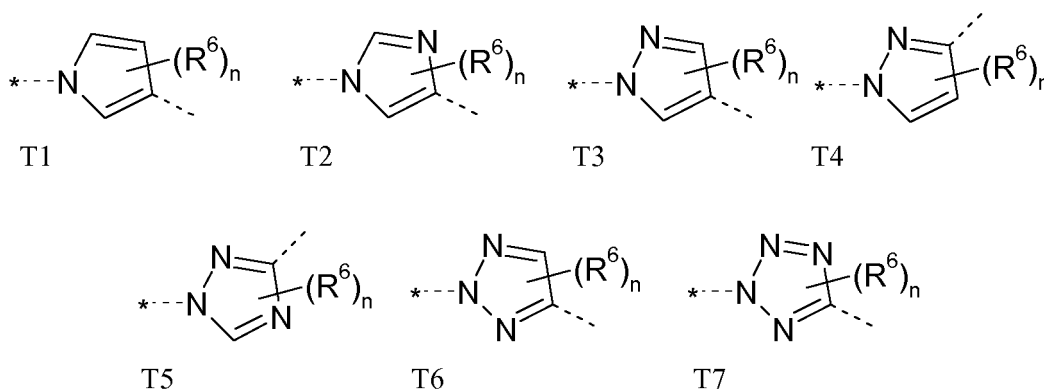
A<sup>1</sup> und A<sup>4</sup> jeweils für CH stehen,

A<sup>2</sup> für CH oder N stehen

A<sub>3</sub> für CR<sup>4</sup> und

R<sup>4</sup> für Methyl, Ethyl, Fluor, Chlor, Brom oder Iod steht,

T für einen der nachfolgend aufgeführten 5 gliedrigen Heteroaromaten T1-T7 steht, wobei die Bindung zur Pyrazolkopfgruppe mit einem Sternchen gekennzeichnet ist,



wobei

R<sup>6</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, 2-Methylethyl, 2,2-Dimethylethyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Nitro, Trifluormethyl, Amino steht,

W für Sauerstoff steht und

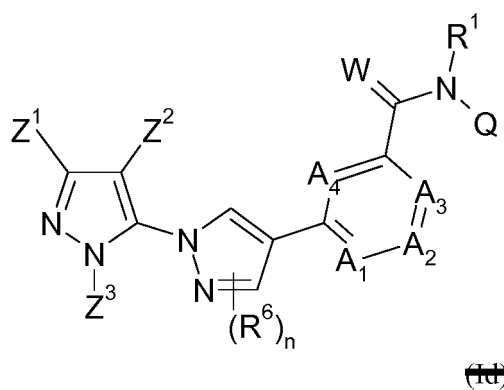
Q für für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, 1,1-Dimethylethyl, n-Butyl, 1-Methylpropyl, 2-ethylpropyl, 2-ethylbutyl, Hydroxyethyl, 2-Hydroxypropyl, Cyanomethyl, 2-Cyanoethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-Trifluormethylethyl, 2,2-Difluorpropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 2,2-Dimethyl-3-fluorpropyl, Cyclopropyl, 1-Cyano-cyclopropyl, 1-Methoxycarbonyl-cyclopropyl, 1-(N-Methylcarbamoyl)cyclopropyl, 1-(N-Cyclopropylcarbamoyl) cyclopropyl, Cyclopropyl-methyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, 1-Cyclopropylethyl, Bis(cyclopropyl)methyl, 2,2-Dimethylcyclopropyl-methyl, 2-Phenylcyclopropyl, 2,2-Dichlorcyclopropyl, trans-2-Chlorcyclopropyl, cis-2-Chlorcyclopropyl, 2,2-Difluorcyclopropyl, trans-2-Fluorcyclopropyl, cis-2-Fluorcyclopropyl, trans-4-Hydroxycyclohexyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl, Prop-2-enyl, 2-Methylprop-2-enyl, Prop-2-inyl, 1,1-Dimethylbut-2-inyl, 3-Chlor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-prop-2-enyl, 3,3-Dichlor-1,1-dimethylprop-2-enyl, Phenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, Oxetan-3-yl, Thietan-3-yl, 1-Oxido-thietan-3-yl,

1,1-Dioxido-thietan-3-yl, Isoxazol-3-ylmethyl, 1,2,4-Triazol-3-ylmethyl, 3-Methyloxetan-3-ylmethyl, Benzyl, 2,6-Difluorphenylmethyl, 3-Fluorphenylmethyl, 2-Fluorphenylmethyl, 2,5-Difluorphenylmethyl, 1-Phenylethyl, 4-Chlorphenylethyl, 2-Trifluormethylphenylethyl, 1-Pyridin-2-ylethyl, Pyridin-2-ylmethyl, (6-Chlor-pyridin-3-yl)methyl, 5-Fluorpyridin-2-ylmethyl, Pyrimidin-2-ylmethyl, Methoxy, 2-Ethoxyethyl, 2-(Methylsulfanyl)ethyl, 1-Methyl-2-(ethylsulfanyl)ethyl, 2-Methyl-1-(methylsulfanyl)propan-2-yl, Methoxycarbonyl, Methoxycarbonylmethyl, NH<sub>2</sub>, N-Ethylamino, N-Allylamino, N,N-Dimethylamino, N,N-Diethylamino steht; oder

Q für ein mit 0 - 4 Substituenten V substituiertes Phenyl, Naphthyl, Pyridazin, Pyrazin, Pyrimidin, Triazin, Pyridin, Pyrazol, Thiazol, Isothiazol, Oxazol, Isoxazol, Triazol, Imidazol, Furan, Thiophen, Pyrrol, Oxadiazol, Thiadiazol steht, wobei

V unabhängig voneinander für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Dichlorfluormethyl, Trifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,2,2,2-Tetrafluorethyl, 1-Chlor-1,2,2,2-tetrafluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 1,1-Difluorethyl, Pentafluorethyl, Heptafluor-tert-butyl, Heptafluor-n-propyl, Heptafluor-isopropyl, Nonafluor-n-butyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Dichlor-fluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, Pentafluorethoxy, N-Methoxyiminomethyl, 1-(N-Methoxyimino)-ethyl, Methylsulfanyl, Methylsulfonyl, Methylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfanyl, N,N-Dimethylamino steht.

4. Verbindungen nach Anspruch 1 der allgemeinen Formel I(c)



in denen die Reste A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>6</sup>, W, Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup> und Z<sup>3</sup> gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3 definiert sind.

5. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 zur Bekämpfung von Insekten, Spinnentieren und Nematoden, wobei die chirurgische, therapeutische und diagnostische Behandlung des menschlichen oder tierischen Körpers ausgeschlossen ist.

6. Pharmazeutische Zusammensetzungen, enthaltend wenigstens eine Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4.

7. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 zur Verwendung als Arzneimittel.

8. Verwendung von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 zur Herstellung pharmazeutischer Zusammensetzungen zur Bekämpfung von Parasiten auf Tieren.

9. Verfahren zur Herstellung von Pflanzenschutzmitteln enthaltend Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, sowie übliche Streckmittel und/oder oberflächenaktive Substanzen.

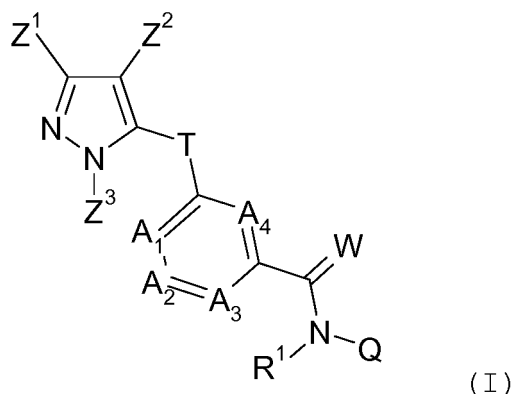
10. Verfahren zum Bekämpfen von Schädlingen, **dadurch gekennzeichnet, dass** man eine Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 auf die Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt, wobei die chirurgische, therapeutische und diagnostische Behandlung des menschlichen oder tierischen Körpers ausgeschlossen ist.

11. Verwendung von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 zum Schutz des Vermehrungsmaterials von Pflanzen.

12. Die Verbindung 4-Brom-2'-methyl-4'-(methylsulfinyl)-5'-(trifluormethyl)-2'H-1,3'-bipyrazol.

### Claims

1. Compounds of the general formula (I),



in which

R<sup>1</sup> represents hydrogen or represents C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxycarbonyl, aryl- (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, heteroaryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl which are optionally mono- or polysubstituted independently of one another by halogen, cyano, alkoxy and alkoxycarbonyl, the chemical groupings

A<sub>1</sub> represents CR<sup>2</sup> or nitrogen,

A<sub>2</sub> represents CR<sup>3</sup> or nitrogen,

A<sub>3</sub> represents CR<sup>4</sup> or nitrogen and

A<sub>4</sub> represents CR<sup>5</sup> or nitrogen,

but where not more than three of the chemical groupings A<sub>1</sub> to A<sub>4</sub> simultaneously represent nitrogen;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup> independently of one another represent hydrogen, halogen, cyano, nitro, optionally substituted C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy-imino-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylsulphonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylsulphinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylsulphonyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino or N,N-di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino;

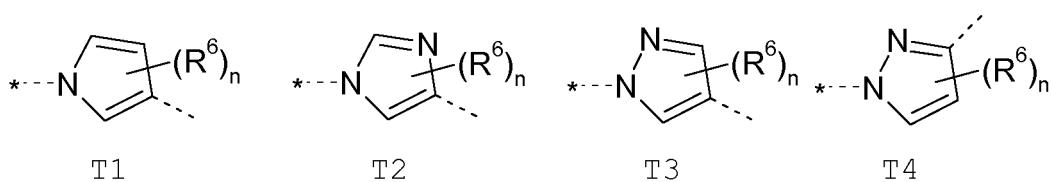
W represents oxygen or sulphur;

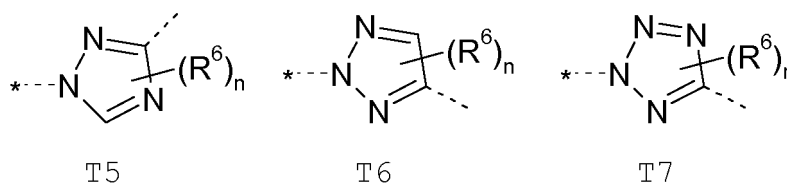
Q represents hydrogen, hydroxy, formyl or one of the groupings C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-heterocycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-hydroxyalkyl, aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, heteroaryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylcarbonylamino or N,N-di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino which are optionally mono- or polysubstituted independently of one another by hydroxy, nitro, amino, halogen, alkoxy, cyano, hydroxycarbonyl, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyl, cycloalkylcarbonyl, phenyl; or

Q represents aryl substituted by 0 - 4 substituents V or a 5- or 6-membered heteroaromatic substituted by 0 - 4 substituents V, where

V independently of one another represent halogen, cyano, nitro, optionally substituted C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy-imino-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylsulphonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylsulphinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylsulphonyl, N,N-di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl) amino;

T represents one of the 5-membered heteroaromatics T1-T7 listed below, where the bond to the pyrazole head group is marked with an asterisk,





where

$R^6$  independently of one another represent halogen, cyano, nitro, amino or optionally halogen-substituted  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -alkyloxy,  $C_1-C_6$ -alkylcarbonyl,  $C_1-C_6$ -alkylsulphanyl,  $C_1-C_6$ -alkylsulphinyl,  $C_1-C_6$ -alkylsulphonyl, and

$n$  represents the values 0-1;

$Z^1$  represents optionally substituted  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_3-C_6$ -cycloalkyl, and

$Z^2$  represents hydrogen, halogen, cyano, nitro, amino or optionally substituted  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -alkylcarbonyl,  $C_1-C_6$ -alkylsulphanyl,  $C_1-C_6$ -alkylsulphinyl,  $C_1-C_6$ -alkylsulphonyl, and

$Z^3$  represents hydrogen or optionally substituted  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_3-C_6$ -cycloalkyl,  $C_1-C_4$ -alkenyl,  $C_1-C_4$ -alkynyl, aryl and hetaryl.

2. Compounds according to Claim 1 in which

$R^1$  represents hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl, t-butyl, methoxymethyl, ethoxymethyl, propoxymethyl, methylcarbonyl, ethylcarbonyl, n-propylcarbonyl, isopropylcarbonyl, s-butylcarbonyl, t-butylcarbonyl, methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl, n-propoxycarbonyl, isopropoxycarbonyl, s-butoxycarbonyl, t-butoxycarbonyl, cyanomethyl, 2-cyanoethyl, benzyl, 4-methoxybenzyl, pyrid-2-ylmethyl, pyrid-3-ylmethyl, pyrid-4-ylmethyl, 4-chloropyrid-3-ylmethyl;

the chemical groupings

$A_1$  represents  $CR^2$  or nitrogen,

$A_2$  represents  $CR^3$  or nitrogen,

$A_3$  represents  $CR^4$  or nitrogen and

$A_4$  represents  $CR^5$  or nitrogen,

but where not more than three of the chemical groupings  $A_1$  to  $A_4$  simultaneously represent nitrogen;

$R^2$  and  $R^5$  independently of one another represent hydrogen, methyl, fluorine or chlorine and

$R^3$  and  $R^4$  independently of one another represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, nitro, methyl, ethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, chlorodifluoromethyl, trifluoromethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, methoxy, ethoxy, n-propoxy, 1-methylethoxy, fluoromethoxy, difluoromethoxy, chlorodifluoromethoxy, dichlorofluoromethoxy, trifluoromethoxy, 2,2,2-trifluoroethoxy, 2-chloro-2,2-difluoroethoxy, pentafluoroethoxy, *N*-methoxyiminomethyl, 1-(*N*-methoxyimino)ethyl, methylsulphanyl, trifluoromethylsulphanyl, methylsulphonyl, methylsulphinyl, trifluoromethylsulphonyl, trifluoromethylsulphinyl;

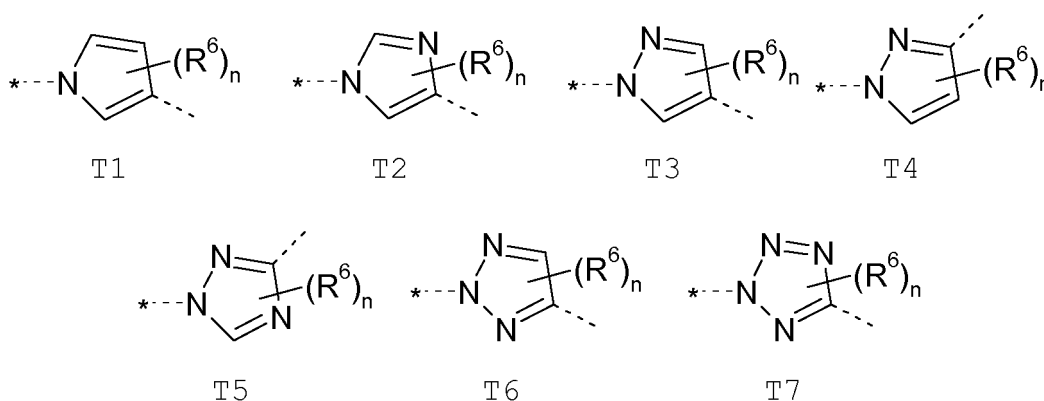
$W$  represents oxygen or sulphur;

$Q$  represents hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl, 1-methylethyl, 1,1-dimethylethyl, 1-methylpropyl, n-butyl, 2-methylpropyl, 2-methylbutyl, hydroxyethyl, 2-hydroxypropyl, cyanomethyl, 2-cyanoethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 1-trifluoromethylethyl, 2,2-difluoropropyl, 3,3,3-trifluoropropyl, 2,2-dimethyl-3-fluoropropyl, cyclopropyl, 1-cyanocyclopropyl, 1-methoxycarbonylcyclopropyl, 1-(*N*-methylcarbamoyl)cyclopropyl, 1-(*N*-cyclopropylcarbamoyl)cyclopropyl, cyclopropylmethyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, 1-cyclopropylethyl, bis(cyclopropyl)methyl, 2,2-dimethylcyclopropylmethyl, 2-phenylcyclopropyl, 2,2-dichlorocyclopropyl, trans-2-chlorocyclopropyl, cis-2-chlorocyclopropyl, 2,2-difluorocyclopropyl, trans-2-fluorocyclopropyl, cis-2-fluorocyclopropyl, trans-4-hydroxycyclohexyl, 4-trifluoromethylcyclohexyl, prop-2-enyl, 2-methylprop-2-enyl, prop-2-ynyl, 1,1-dimethylbut-2-ynyl, 3-chloroprop-2-enyl, 3,3-dichloroprop-2-enyl, 3,3-dichloro-1,1-dimethylprop-2-enyl, phenyl, 2-chlorophenyl, 3-chlorophenyl, 4-chlorophenyl, oxetan-3-yl, thietan-3-yl, 1-oxidothietan-3-yl, 1,1-dioxidothietan-3-yl, isoxazol-3-ylmethyl, 1,2,4-triazol-3-ylmethyl, 3-methyloxetan-3-ylmethyl, benzyl, 2,6-difluorophenylmethyl, 3-fluorophenylmethyl, 2-fluorophenylmethyl, 2,5-difluorophenylmethyl, 1-phenylethyl, 4-chlorophenylethyl, 2-trifluoromethylphenylethyl, 1-pyridin-2-ylethyl, pyridin-2-ylmethyl, 5-fluoropyridin-2-ylmethyl, (6-chloropyridin-3-yl)methyl, pyrimidin-2-ylmethyl, methoxy, 2-ethoxyethyl, 2-(methylsulphanyl)ethyl, 1-methyl-2-(ethylsulphanyl)ethyl, 2-methyl-1-(methylsulphanyl)propan-2-yl, methoxycarbonyl, methoxycarbonylmethyl,  $NH_2$ , *N*-ethylamino, *N*-allylamino, *N,N*-dimethylamino, *N,N*-diethylamino; or

Q represents phenyl, naphthyl, pyridazine, pyrazine, pyrimidine, triazine, pyridine, pyrazole, thiazole, isothiazole, oxazole, isoxazole, triazole, imidazole, furan, thiophene, pyrrole, oxadiazole, thiadiazole substituted by 0 - 4 substituents V, where

V independently of one another represent fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, nitro, methyl, ethyl, difluoromethyl, trichloromethyl, chlorodifluoromethyl, dichlorofluoromethyl, trifluoromethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 1,2,2,2-tetrafluoroethyl, 1-chloro-1,2,2,2-tetrafluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 1,1-difluoroethyl, pentafluoroethyl, pentafluoro-tert-butyl, heptafluoro-n-propyl, heptafluoroisopropyl, nonafluoro-n-butyl, cyclopropyl, cyclobutyl, methoxy, ethoxy, n-propoxy, 1-methylethoxy, fluoromethoxy, difluoromethoxy, chlorodifluoromethoxy, dichlorofluoromethoxy, trifluoromethoxy, 2,2,2-trifluoroethoxy, 2-chloro-2,2-difluoroethoxy, pentafluoroethoxy, *N*-methoxyiminomethyl, 1-(*N*-methoxyimino)ethyl, methylsulphanyl, methylsulphonyl, methylsulphinyl, trifluoromethylsulphonyl, trifluoromethylsulphinyl, trifluoromethylsulphanyl, *N,N*-dimethylamino;

T represents one of the 5-membered heteroaromatics T1-T7 listed below, where the bond to the pyrazole head group is marked with an asterisk,



where

$R^6$  independently of one another represent halogen, cyano, nitro, amino, methyl, ethyl, 1-methylethyl, tert-butyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, methoxy, ethoxy, trifluoromethoxy, 2,2-difluoroethoxy, 2,2,2-trifluoroethoxy, methylcarbonyl, ethylcarbonyl, trifluoromethylcarbonyl, methylsulphanyl, methylsulphinyl, methylsulphonyl, trifluoromethylsulphonyl, trifluoromethylsulphanyl, trifluoromethylsulphinyl, and *n* represents the values 0-1;

$Z^1$  represents methyl, ethyl, 1,1-dimethylethyl, difluoromethyl, trichloromethyl, chlorodifluoromethyl, dichlorofluoromethyl, trifluoromethyl, bromodichloromethyl, 1-fluoroethyl, 1-fluoro-1-methylethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 1,2,2,2-tetrafluoroethyl, 1-chloro-1,2,2,2-tetrafluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 1,1-difluoroethyl, pentafluoroethyl, pentafluoro-tert-butyl, heptafluoro-n-propyl, heptafluoroisopropyl, nonafluoro-n-butyl, cyclopropyl, 1-chlorocyclopropyl, 1-fluorocyclopropyl, 1-bromocyclopropyl, 1-cyanocyclopropyl, 1-trifluoromethylcyclopropyl, cyclobutyl and 2,2-difluoro-1-methylcyclopropyl, and

$Z^2$  represents hydrogen, halogen, cyano, nitro, amino, methyl, ethyl, 1,1-dimethylethyl, difluoromethyl, trichloromethyl, chlorodifluoromethyl, dichlorofluoromethyl, trifluoromethyl, bromodichloromethyl, 1-fluoroethyl, 1-fluoro-1-methylethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 1,2,2,2-tetrafluoroethyl, 1-chloro-1,2,2,2-tetrafluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 1,1-difluoroethyl, pentafluoroethyl, pentafluoro-tert-butyl, heptafluoro-n-propyl, heptafluoroisopropyl, nonafluoro-n-butyl, methylsulphanyl, methylsulphinyl, methylsulphonyl, ethylthio, ethylsulphinyl, ethylsulphonyl, trifluoromethylsulphanyl, trifluoromethylsulphinyl, trifluoromethylsulphonyl, chlorodifluoromethylsulphanyl, chlorodifluoromethylsulphinyl, chlorodifluoromethylsulphonyl, dichlorofluoromethylsulphanyl, dichlorofluoromethylsulphinyl, dichlorofluoromethylsulphonyl and

$Z^3$  represents hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl, t-butyl, ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-propynyl, 1-butylnyl, difluoromethyl, trichloromethyl, chlorodifluoromethyl, dichlorofluoromethyl, trifluoromethyl, 1-fluoroethyl, 1-fluoro-1-methylethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, phenyl, 2-chlorophenyl, 3-chlorophenyl, 4-chlorophenyl, 2,5-dichlorophenyl, 3,4-dichlorophenyl, 2,6-dichlorophenyl, 2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl, 3-chloro-5-trifluoromethylpyridin-2-yl.

### 3. Compounds according to Claim 1 or 2 in which

Z<sup>1</sup> represents trifluoromethyl, 1-chlorocyclopropyl, 1-fluorocyclopropyl or pentafluoroethyl,

Z<sup>2</sup> represents trifluoromethyl, nitro, methylsulphonyl, methylsulphinyl, methylsulphonyl, fluorine, chlorine, bromine, cyano or iodine,

Z<sup>3</sup> represents methyl, ethyl, n-propyl or hydrogen,

R<sup>1</sup> represents hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl, t-butyl, methoxymethyl, ethoxymethyl, propoxymethyl, methylcarbonyl, ethylcarbonyl, n-propylcarbonyl, isopropylcarbonyl, s-butylcarbonyl, t-butylcarbonyl, methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl, n-propoxycarbonyl, isopropoxycarbonyl, s-butoxycarbonyl, t-butoxycarbonyl, cyanomethyl, 2-cyanoethyl, benzyl, 4-methoxybenzyl, pyrid-2-ylmethyl, pyrid-3-ylmethyl, pyrid-4-ylmethyl, 4-chloropyrid-3-ylmethyl,

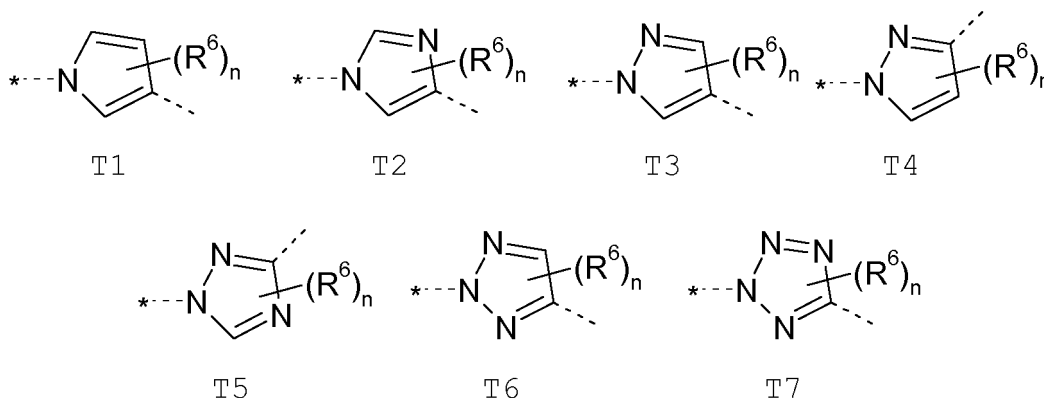
A<sup>1</sup> and A<sup>4</sup> each represent CH,

A<sup>2</sup> represents CH or N,

A<sub>3</sub> represents CR<sup>4</sup> and

R<sup>4</sup> represents methyl, ethyl, fluorine, chlorine, bromine or iodine,

T represents one of the 5-membered heteroaromatics T1-T7 listed below, where the bond to the pyrazole head group is marked with an asterisk,



where

R<sup>6</sup> represents hydrogen, methyl, ethyl, 2-methylethyl, 2,2-dimethylethyl, fluorine, chlorine, bromine, iodine, nitro, trifluoromethyl, amino

W represents oxygen and

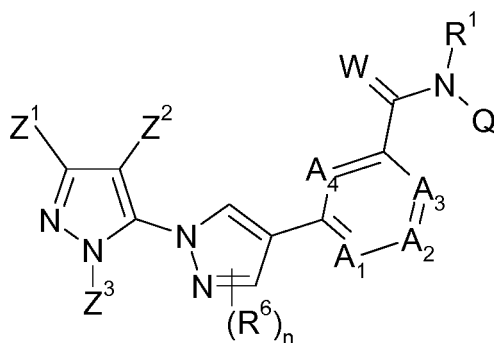
Q represents hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl, 1-methylethyl, 1,1-dimethylethyl, n-butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 2-methylbutyl, hydroxyethyl, 2-hydroxypropyl, cyanomethyl, 2-cyanoethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 1-trifluoromethylethyl, 2,2-difluoropropyl, 3,3,3-trifluoropropyl, 2,2-dimethyl-3-fluoropropyl, cyclopropyl, 1-cyanocyclopropyl, 1-methoxycarbonylcyclopropyl, 1-(*N*-methylcarbamoyl)cyclopropyl, 1-(*N*-cyclopropylcarbamoyl)cyclopropyl, cyclopropylmethyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, 1-cyclopropylethyl, bis(cyclopropyl)methyl, 2,2-dimethylcyclopropylmethyl, 2-phenylcyclopropyl, 2,2-dichlorocyclopropyl, trans-2-chlorocyclopropyl, cis-2-chlorocyclopropyl, 2,2-difluorocyclopropyl, trans-2-fluorocyclopropyl, cis-2-fluorocyclopropyl, trans-4-hydroxycyclohexyl, 4-trifluoromethylcyclohexyl, prop-2-enyl, 2-methylprop-2-enyl, prop-2-ynyl, 1,1-dimethylbut-2-ynyl, 3-chloroprop-2-enyl, 3,3-dichloroprop-2-enyl, 3,3-dichloro-1,1-dimethylprop-2-enyl, phenyl, 2-chlorophenyl, 3-chlorophenyl, 4-chlorophenyl, oxetan-3-yl, thietan-3-yl, 1-oxidothietan-3-yl, 1,1-dioxidothietan-3-yl, isoxazol-3-ylmethyl, 1,2,4-triazol-3-ylmethyl, 3-methyloxetan-3-ylmethyl, benzyl, 2,6-difluorophenylmethyl, 3-fluorophenylmethyl, 2-fluorophenylmethyl, 2,5-difluorophenylmethyl, 1-phenylethyl, 4-chlorophenylethyl, 2-trifluoromethylphenylethyl, 1-pyridin-2-ylethyl, pyridin-2-ylmethyl, (6-chloropyridin-3-yl)methyl, 5-fluoropyridin-2-ylmethyl, pyrimidin-2-ylmethyl, methoxy, 2-ethoxyethyl, 2-(methylsulphonyl)ethyl, 1-methyl-2-(ethylsulphonyl)ethyl, 2-methyl-1-(methylsulphonyl)propan-2-yl, methoxycarbonyl, methoxycarbonylmethyl, NH<sub>2</sub>, *N*-ethylamino, *N*-allylamino, *N,N*-dimethylamino, *N,N*-diethylamino; or

Q represents phenyl, naphthyl, pyridazine, pyrazine, pyrimidine, triazine, pyridine, pyrazole, thiazole, isothiazole, oxazole, isoxazole, triazole, imidazole, furan, thiophene, pyrrole, oxadiazole, thiadiazole substituted by 0 - 4 substituents V, where

V independently of one another represent fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, nitro, methyl, ethyl, difluoromethyl, trichloromethyl, chlorodifluoromethyl, dichlorofluoromethyl, trifluoromethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 1,2,2,2-tetrafluoroethyl, 1-chloro-1,2,2,2-tetrafluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 1,1-difluoroethyl, pentafluoroethyl, pentafluoro-tert-butyl, heptafluoro-n-propyl,

heptafluoroisopropyl, nonafluoro-n-butyl, cyclopropyl, cyclobutyl, methoxy, ethoxy, n-propoxy, 1-methylethoxy, fluoromethoxy, difluoromethoxy, chlorodifluoromethoxy, dichlorofluoromethoxy, trifluoromethoxy, 2,2,2-trifluoroethoxy, 2-chloro-2,2-difluoroethoxy, pentafluoroethoxy, *N*-methoxyiminomethyl, 1-(*N*-methoxyimino)ethyl, methylsulphanyl, methylsulphonyl, methylsulphinyl, trifluoromethylsulphonyl, trifluoromethylsulphinyl, trifluoromethylsulphanyl, *N,N*-dimethylamino.

4. Compounds according to Claim 1 of the general formula I (c)



(Ic)

in which the radicals A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>, A<sup>4</sup>, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>6</sup>, W, Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup> and Z<sup>3</sup> are defined according to any of Claims 1 to 3.

5. Use of compounds of the general formula (I) according to any of Claims 1 to 4 for controlling insects, arachnids and nematodes, wherein the surgical, therapeutic and diagnostic treatment of the human or animal body is excluded.
6. Pharmaceutical compositions comprising at least one compound according to any of Claims 1 to 4.
7. Compounds according to any of Claims 1 to 4 for use as medicaments.
8. Use of compounds according to any of Claims 1 to 4 for preparing pharmaceutical compositions for controlling parasites on animals.
9. Process for preparing crop protection compositions comprising compounds according to any of Claims 1 to 4 and customary extenders and/or surfactants.
10. Method for controlling pests, **characterized in that** a compound according to any of Claims 1 to 4 is allowed to act on the pests and/or their habitat, wherein the surgical, therapeutic and diagnostic treatment of the human or animal body is excluded.
11. Use of compounds according to any of Claims 1 to 4 for protecting the propagation material of plants.
12. The compound 4-bromo-2'-methyl-4'-(methylsulphinyl)-5'-(trifluoromethyl)-2'H-1,3'-bipyrazole.

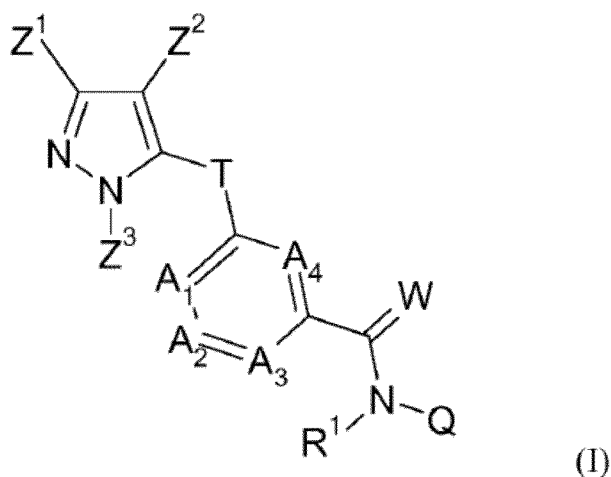
## Revendications

1. Composés de formule générale (I)

5

10

15



dans lesquels

20

R<sup>1</sup> représente hydrogène, alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcényle en C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcynyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alkylcarbonyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxycarbonyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, aryl-alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, hétéroaryl-alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, éventuellement substitués une ou plusieurs fois indépendamment les uns des autres avec halogène, cyano, alcoxy et alcoxycarbonyle, le groupement chimique

25

A<sub>1</sub> représente CR<sup>2</sup> ou azote,

A<sub>2</sub> représente CR<sup>3</sup> ou azote,

A<sub>3</sub> représente CR<sup>4</sup> ou azote et

A<sub>4</sub> représente CR<sup>5</sup> ou azote, pas plus de trois des groupements chimiques A<sub>1</sub> à A<sub>4</sub> ne représentant simultanément azote ;

30

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> et R<sup>5</sup> représentent indépendamment les uns des autres hydrogène, halogène, cyano, nitro, alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> éventuellement substitué, cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxy en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alcoxy en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alkylsulfanyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfinyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfonyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alkylamino en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ou N,N-di-alkylamino en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ;

W représente oxygène ou soufre ;

35

Q représente hydrogène, hydroxy, formyle ou un des groupements alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcényle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcynyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, hétérocycloalkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, alcoxy en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, hydroxyalkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, aryl-alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, hétéroaryl-alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, N-alkylamino en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, N-alkylcarbonylamino en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> ou N,N-di-alkylamino en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> éventuellement substitués indépendamment les uns des autres une ou plusieurs fois avec hydroxy, nitro, amino, halogène, alcoxy, cyano, hydroxycarbonyle, alcoxycarbonyle, alkylcarbamoyle, cycloalkylcarbamoyle, phényle ; ou

40

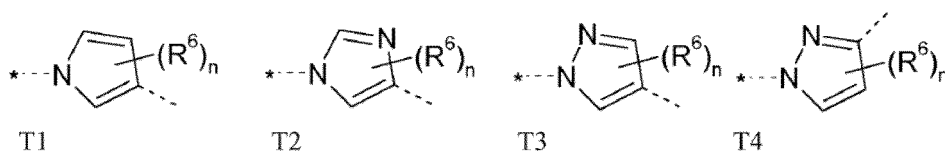
Q représente un aryle substitué avec 0 à 4 substituants V ou un groupe hétéroaromatique à 5 ou 6 chaînons substitué avec 0 à 4 substituants V,

les V représentant indépendamment les uns des autres halogène, cyano, nitro, alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> éventuellement substitué, alcényle en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcynyle en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxy en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alcoxy en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alkylsulfanyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfinyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfonyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N,N-di-alkylamino en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ;

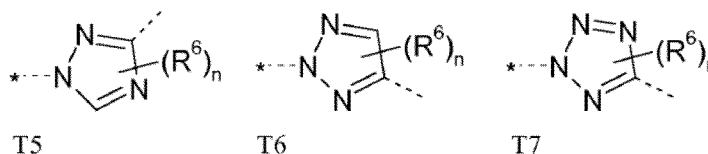
45

T représente un des groupes hétéroaromatiques à 5 chaînons T1 à T7 listés ci-après, la liaison au groupe de tête pyrazole étant **caractérisée** avec un astérisque,

50



55



5

10

15

les R<sup>6</sup> représentant indépendamment les uns des autres halogène, cyano, nitro, amino ou un alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkyloxy en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylcarbonyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfanyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfinyne en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfonyne en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> éventuellement substitué avec halogène, et

les n représentant les valeurs 0 à 1 ;

Z<sup>1</sup> représente un alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> éventuellement substitué, cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, et

Z<sup>2</sup> représente hydrogène, halogène, cyano, nitro, amino ou un alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylcarbonyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfanyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfinyne en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alkylsulfonyne en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> éventuellement substitué, et

Z<sup>3</sup> représente hydrogène ou un alkyle en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cycloalkyle en C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcényne en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcynyle en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, aryle et hétéryle éventuellement substitué.

## 2. Composés selon la revendication 1, dans lesquels

20

R<sup>1</sup> représente hydrogène, méthyle, éthyle, n-propyle, isopropyle, n-butyle, isobutyle, s-butyle, t-butyle, méthoxyméthyle, éthoxyméthyle, propoxyméthyle, méthylcarbonyle, éthylcarbonyle, n-propylcarbonyle, isopropylcarbonyle, s-butylcarbonyle, t-butylcarbonyle, méthoxycarbonyle, éthoxycarbonyle, n-propoxycarbonyle, isopropoxycarbonyle, s-butoxycarbonyle, t-butoxycarbonyle, cyanométhyle, 2-cyanoéthyle, benzyle, 4-méthoxybenzyle, pyrid-2-yl-méthyle, pyrid-3-yl-méthyle, pyrid-4-yl-méthyle, 4-chloro-pyrid-3-yl-méthyle ;

le groupement chimique

25

A<sub>1</sub> représente CR<sup>2</sup> ou azote,

A<sub>2</sub> représente CR<sup>3</sup> ou azote,

A<sub>3</sub> représente CR<sup>4</sup> ou azote et

A<sub>4</sub> représente CR<sup>5</sup> ou azote,

pas plus de trois des groupements chimiques A<sub>1</sub> à A<sub>4</sub> ne représentant simultanément azote ;

30

R<sup>2</sup> et R<sup>5</sup> représentent indépendamment les uns des autres hydrogène, méthyle, fluor et chlore, et

35

R<sup>3</sup> et R<sup>4</sup> représentent indépendamment les uns des autres hydrogène, fluor, chlore, brome, iode, cyano, nitro, méthyle, éthyle, fluorométhyle, difluorométhyle, chlorodifluorométhyle, trifluorométhyle, 2,2,2-trifluoroéthyle, méthoxy, éthoxy, n-propoxy, 1-méthyléthoxy, fluorométhoxy, difluorométhoxy, chlorodifluorométhoxy, dichloro-fluorométhoxy, trifluorométhoxy, 2,2,2-trifluoroéthoxy, 2-chloro-2,2-difluoroéthoxy, pentafluoroéthoxy, N-méthoxyimino-méthyle, 1-(N-méthoxyimino)-éthyle, méthylsulfanyle, trifluorométhylsulfanyle, méthylsulfonyne, méthylsulfinyne, trifluorométhylsulfonyne, trifluorométhylsulfinyne ;

W représente oxygène ou soufre ;

40

Q représente hydrogène, méthyle, éthyle, n-propyle, 1-méthyléthyle, 1,1-diméthyléthyle, 1-méthylpropyle, n-butyle, 2-méthylpropyle, 2-méthylbutyle, hydroxyéthyle, 2-hydroxypropyle, cyanométhyle, 2-cyanoéthyle, 2-fluoroéthyle, 2,2-difluoroéthyle, 2,2,2-trifluoroéthyle, 1-trifluorométhyléthyle, 2,2-difluoropropyle, 3,3,3-trifluoropropyle, 2,2-diméthyl-3-fluoropropyle, cyclopropyle, 1-cyano-cyclopropyle, 1-méthoxycarbonyl-cyclopropyle, 1-(N-méthylcarbamoyle)cyclopropyle, 1-(N-cyclopropylcarbamoyle)-cyclopropyle, cyclopropyl-méthyle, cyclobutyle, cyclopentyle, cyclohexyle, 1-cyclopropyléthyle, bis(cyclopropyl)méthyle, 2,2-diméthylcyclopropyl-méthyle, 2-phénylcyclopropyle, 2,2-dichlorocyclopropyle, trans-2-chlorocyclopropyle, cis-2-chlorocyclopropyle, 2,2-difluorocyclopropyle, trans-2-fluorocyclopropyle, cis-2-fluorocyclopropyle, trans-4-hydroxycyclohexyle, 4-trifluorométhylcyclohexyle, prop-2-ényne, 2-méthylprop-2-ényne, prop-2-inyle, 1,1-diméthylbut-2-inyle, 3-chloro-prop-2-ényne, 3,3-dichloro-prop-2-ényne, 3,3-dichloro-1,1-diméthylprop-2-ényne, phényle, 2-chlorophényle, 3-chlorophényle, 4-chlorophényle, oxétan-3-yle, thiétan-3-yle, 1-oxydo-thiétan-3-yle, 1,1-dioxydo-thiétan-3-yle, isoxazol-3-ylméthyle, 1,2,4-triazol-3-ylméthyle, 3-méthylxétan-3-ylméthyle, benzyle, 2,6-difluorophénylméthyle, 3-fluorophénylméthyle, 2-fluorophénylméthyle, 2,5-difluorophénylméthyle, 1-phényléthyle, 4-chlorophényléthyle, 2-trifluorométhylphényléthyle, 1-pyridin-2-yléthyle, pyridin-2-ylméthyle, 5-fluoropyridin-2-ylméthyle, (6-chloro-pyridin-3-yl)méthyle, pyrimidin-2-ylméthyle, méthoxy, 2-éthoxyéthyle, 2-(méthylsulfanyl)éthyle, 1-méthyl-2-(éthylsulfanyl)éthyle, 2-méthyl-1-(méthylsulfanyl)propan-2-yle, méthoxycarbonyle, méthoxycarbonylméthyle, NH<sub>2</sub>, N-éthylamino, N-allylamino, N,N-diméthylamino, N,N-diéthylamino ; ou

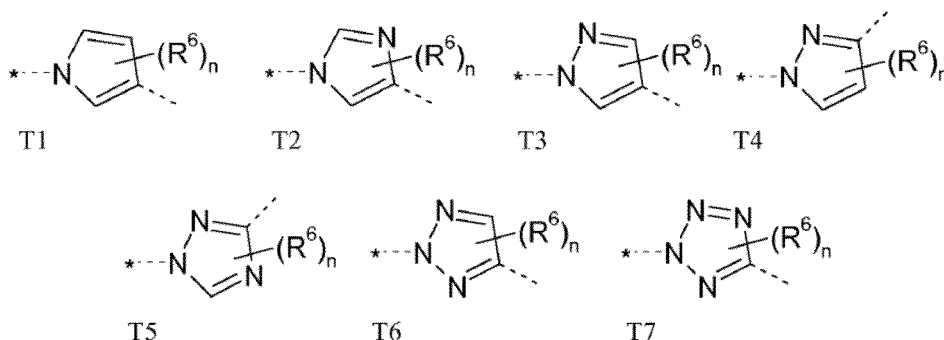
55

Q représente un phényle, naphyle, pyridazine, pyrazine, pyrimidine, triazine, pyridine, pyrazole, thiazole, isothiazole, oxazole, isoxazole, triazole, imidazole, furane, thiophène, pyrrole, oxadiazole, thiadiazole substitué avec 0 à 4 substituants V,

les V représentant indépendamment les uns des autres fluore, chlore, brome, iode, cyano, nitro, méthyle, éthyle, difluorométhyle, trichlorométhyle, chlorodifluorométhyle, dichlorofluorométhyle, trifluorométhyle, 1-fluoroéthyle, 2-

fluoroéthyle, 2,2-difluoroéthyle, 2,2,2-trifluoroéthyle, 1,2,2,2-tétrafluoroéthyle, 1-chloro-1,2,2,2-tétrafluoroéthyle, 2,2,2-trichloroéthyle, 2-chloro-2,2-difluoroéthyle, 1,1-difluoroéthyle, pentafluoroéthyle, pentafluoro-tert-butyle, heptafluoro-n-propyle, heptafluoro-isopropyle, nonafluoro-n-butyle, cyclopropyle, cyclobutyle, méthoxy, éthoxy, n-propoxy, 1-méthyléthoxy, fluorométhoxy, difluorométhoxy, chlorodifluorométhoxy, dichloro-fluorométhoxy, trifluorométhoxy, 2,2,2-trifluoroéthoxy, 2-chloro-2,2-difluoroéthoxy, pentafluoroéthoxy, N-méthoxyiminométhyle, 1-(N-méthoxyimino)-éthyle, méthylsulfanyle, méthylsulfonyle, méthylsulfinyne, trifluorométhylsulfonyle, trifluorométhylsulfinyne, trifluorométhylsulfanyle, N,N-diméthylamino ;

T représente un des groupes hétéroaromatiques à 5 chaînons T1 à T7 listés ci-après, la liaison au groupe de tête pyrazole étant **caractérisée** avec un astérisque,



les R<sup>6</sup> représentant indépendamment les uns des autres halogène, cyano, nitro, amino, méthyle, éthyle, 1-méthyléthyle, tert-butyle, trifluorométhyle, difluorométhyle, méthoxy, éthoxy, trifluorométhoxy, 2,2-difluoroéthoxy, 2,2,2-trifluoroéthoxy, méthylcarbonyle, éthylcarbonyle, trifluorométhylcarbonyle, méthylsulfanyle, méthylsulfinyne, méthylsulfonyle, trifluorométhylsulfonyle, trifluorométhylsulfanyle, trifluorométhylsulfinyne, et

les n représentant les valeurs 0 à 1 ;

Z<sup>1</sup> représente méthyle, éthyle, 1,1-diméthyléthyle, difluorométhyle, trichlorométhyle, chlorodifluorométhyle, dichlorodifluorométhyle, trifluorométhyle, bromodichlorométhyle, 1-fluoroéthyle, 1-fluoro-1-méthyléthyle, 2-fluoroéthyle, 2,2-difluoroéthyle, 2,2,2-trifluoroéthyle, 1,2,2,2-tétrafluoroéthyle, 1-chloro-1,2,2,2-tétrafluoroéthyle, 2,2,2-trichloroéthyle, 2-chloro-2,2-difluoroéthyle, 1,1-difluoroéthyle, pentafluoroéthyle, pentafluoro-t-butyle, heptafluoro-n-propyle, heptafluoro-isopropyle, nonafluoro-n-butyle, cyclopropyle, 1-chlorocyclopropyle, 1-fluorocyclopropyle, 1-bromocyclopropyle, 1-cyano-cyclopropyle, 1-trifluorométhyl-cyclopropyle, cyclobutyle et 2,2-difluoro-1-méthyl-cyclopropyle, et

Z<sup>2</sup> représente hydrogène, halogène, cyano, nitro, amino, méthyle, éthyle, 1,1-diméthyléthyle, difluorométhyle, trichlorométhyle, chlorodifluorométhyle, dichlorodifluorométhyle, trifluorométhyle, bromodichlorométhyle, 1-fluoroéthyle, 1-fluoro-1-méthyléthyle, 2-fluoroéthyle, 2,2-difluoroéthyle, 2,2,2-trifluoroéthyle, 1,2,2,2-tétrafluoroéthyle, 1-chloro-1,2,2,2-tétrafluoroéthyle, 2,2,2-trichloroéthyle, 2-chloro-2,2-difluoroéthyle, 1,1-difluoroéthyle, pentafluoroéthyle, pentafluoro-t-butyle, heptafluoro-n-propyle, heptafluoro-isopropyle, nonafluoro-n-butyle, méthylsulfanyle, méthylsulfinyne, méthylsulfonyle, éthylthio, éthylsulfinyne, éthylsulfonyle, trifluorométhylsulfanyle, trifluorométhylsulfinyne, trifluorométhylsulfonyle, chloro-difluorométhylsulfanyle, chlorodifluorométhylsulfinyne, chlorodifluorométhylsulfonyle, dichloro-fluorométhylsulfanyle, dichloro-fluorométhylsulfinyne, dichloro-fluorométhylsulfonyle, et

Z<sup>3</sup> représente hydrogène, méthyle, éthyle, n-propyle, isopropyle, n-butyle, isobutyle, s-butyle, t-butyle, éthényle, 1-propényle, 2-propényle, 1-propinyle, 1-butinyle, difluorométhyle, trichlorométhyle, chlorodifluorométhyle, dichlorodifluorométhyle, trifluorométhyle, 1-fluoroéthyle, 1-fluoro-1-méthyléthyle, 2-fluoroéthyle, 2,2-difluoroéthyle, 2,2,2-trifluoroéthyle, phényle, 2-chlorophényle, 3-chlorophényle, 4-chlorophényle, 2,5-dichlorophényle, 3,4-dichlorophényle, 2,6-dichlorophényle, 2,6-dichloro-4-trifluorométhylphényle, 3-chloro-5-trifluorométhylpyridin-2-yle.

### 3. Composés selon la revendication 1 ou 2, dans lesquels

Z<sup>1</sup> représente trifluorométhyle, 1-chloro-cyclopropyle, 1-fluoro-cyclopropyle ou pentafluoroéthyle,

Z<sup>2</sup> représente trifluorométhyle, nitro, méthylsulfanyle, méthylsulfinyne, méthylsulfonyle, fluor, chlore, brome, cyano ou iode,

Z<sup>3</sup> représente méthyle, éthyle, n-propyle ou hydrogène,

R<sup>1</sup> représente hydrogène, méthyle, éthyle, n-propyle, isopropyle, n-butyle, i-butyle, s-butyle, t-butyle, méthoxyméthyle, éthoxyméthyle, propoxyméthyle, méthylcarbonyle, éthylcarbonyle, n-propylcarbonyle, isopropylcarbonyle, s-butylcarbonyle, t-butylcarbonyle, méthoxycarbonyle, éthoxycarbonyle, n-propoxycarbonyle, isopropoxycarbonyle, s-butoxycarbonyle, t-butoxycarbonyle, cyanométhyle, 2-cyanoéthyle, benzyle, 4-méthoxybenzyle, pyrid-2-yl-méthyle, pyrid-3-yl-méthyle, pyrid-4-yl-méthyle, 4-chloro-pyrid-3-yl-méthyle,

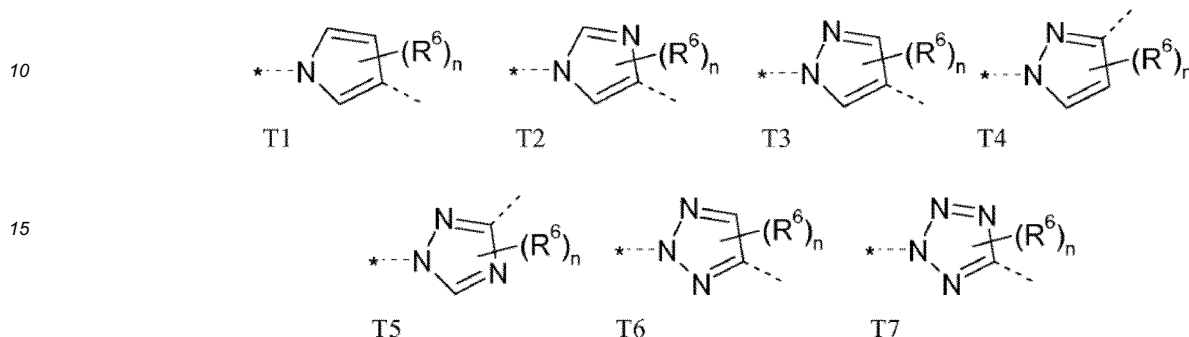
A<sup>1</sup> et A<sup>4</sup> représentent chacun CH,

A<sup>2</sup> représente CH ou N,

A<sup>3</sup> représente CR<sup>4</sup>, et

R<sup>4</sup> représente méthyle, éthyle, fluor, chlore, brome ou iode,

5 T représente un des groupes hétéroaromatiques à 5 chaînons T1 à T7 listés ci-après, la liaison au groupe de tête pyrazole étant **caractérisée** avec un astérisque,



20 les R<sup>6</sup> représentant hydrogène, méthyle, éthyle, 2-méthyléthyle, 2,2-diméthyléthyle, fluor, chlore, brome, iode, nitro, trifluorométhyle, amino,

W représente oxygène et

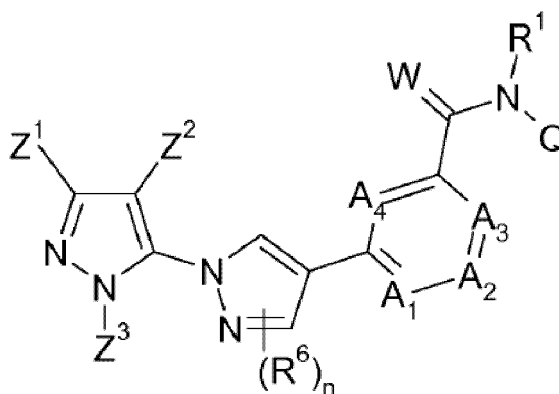
Q représente hydrogène, méthyle, éthyle, n-propyle, 1-méthyléthyle, 1,1-diméthyléthyle, n-butyle, 1-méthylpropyle, 2-méthylpropyle, 2-méthylbutyle, hydroxyéthyle, 2-hydroxypropyle, cyanométhyle, 2-cyanoéthyle, 2-fluoroéthyle,

25 2,2-difluoroéthyle, 2,2,2-trifluoroéthyle, 1-trifluorométhyléthyle, 2,2-difluoropropyle, 3,3,3-trifluoropropyle, 2,2-diméthyl-3-fluoropropyle, cyclopropyle, 1-cyano-cyclopropyle, 1-méthoxycarbonyl-cyclopropyle, 1-(N-méthylcarbamoyle)cyclopropyle, 1-(N-cyclopropylcarbamoyle)cyclopropyle, cyclopropyl-méthyle, cyclobutyle, cyclopentyle, cyclohexyle, 1-cyclopropyléthyle, bis(cyclopropyl)méthyle, 2,2-diméthylcyclopropyl-méthyle, 2-phénylcyclopropyle, 2,2-dichlorocyclopropyle, trans-2-chlorocyclopropyle, cis-2-chlorocyclopropyle, 2,2-difluorocyclopropyle, trans-2-fluorocyclopropyle, cis-2-fluorocyclopropyle, trans-4-hydroxycyclohexyle, 4-trifluorométhylcyclohexyle, prop-2-ényle, 2-méthylprop-2-ényle, prop-2-inyle, 1,1-diméthylbut-2-inyle, 3-chloro-prop-2-ényle, 3,3-dichloro-prop-2-ényle, 3,3-dichloro-1,1-diméthylprop-2-ényle, phényle, 2-chlorophényle, 3-chlorophényle, 4-chlorophényle, oxétan-3-yle, thiétan-3-yle, 1-oxydo-thiétan-3-yle, 1,1-dioxydo-thiétan-3-yle, isoxazol-3-ylméthyle, 1,2,4-triazol-3-ylméthyle, 3-méthylloxétan-3-ylméthyle, benzyle, 2,6-difluorophénylméthyle, 3-fluorophénylméthyle, 2-fluorophénylméthyle, 2,5-difluorophénylméthyle, 1-phényléthyle, 4-chlorophényléthyle, 2-trifluorométhylphényléthyle, 1-pyridin-2-yléthyle, pyridin-2-ylméthyle, (6-chloro-pyridin-3-yl)méthyle, 5-fluoropyridin-2-ylméthyle, pyrimidin-2-ylméthyle, méthoxy, 2-éthoxyéthyle, 2-(méthylsulfanyl)éthyle, 1-méthyl-2-(éthylsulfanyl)éthyle, 2-méthyl-1-(méthylsulfanyl)propan-2-yle, méthoxycarbonyl, méthoxycarbonylméthyle, NH<sub>2</sub>, N-éthylamino, N-allylamino, N,N-diméthylamino, N,N-diéthylamino ; ou Q représente un phényle, naphyle, pyridazine, pyrazine, pyrimidine, triazine, pyridine, pyrazole, thiazole, isothiazole, oxazole, isoxazole, triazole, imidazole, furane, thiophène, pyrrole, oxadiazole, thiadiazole substitué avec 0 à 4 substituants V,

les V représentant indépendamment les uns des autres fluor, chlore, brome, iode, cyano, nitro, méthyle, éthyle, difluorométhyle, trichlorométhyle, chlorodifluorométhyle, dichlorofluorométhyle, trifluorométhyle, 1-fluoroéthyle, 2-fluoroéthyle, 2,2-difluoroéthyle, 2,2,2-trifluoroéthyle, 1,2,2,2-tétrafluoroéthyle, 1-chloro-1,2,2,2-tétrafluoroéthyle, 2,2,2-trichloroéthyle, 2-chloro-2,2-difluoroéthyle, 1,1-difluoroéthyle, pentafluoroéthyle, pentafluoro-tert-butyle, heptafluoro-n-propyle, heptafluoro-isopropyle, nonafluoro-n-butyle, cyclopropyle, cyclobutyle, méthoxy, éthoxy, n-propoxy, 1-méthyléthoxy, fluorométhoxy, difluorométhoxy, chloro-difluorométhoxy, dichloro-fluorométhoxy, trifluorométhoxy, 2,2,2-trifluoroéthoxy, 2-chloro-2,2-difluoroéthoxy, pentafluoroéthoxy, N-méthoxyiminométhyle, 1-(N-méthoxyimino)-éthyle, méthylsulfanyle, méthylsulfonyl, méthylsulfinyl, trifluorométhylsulfonyl, trifluorométhylsulfinyle, trifluorométhylsulfanyle, N,N-diméthylamino.

#### 4. Composés selon la revendication 1 de formule générale I(c)

55



(Ic)

dans laquelle les radicaux  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $A^3$ ,  $A^4$ ,  $Q$ ,  $R^1$ ,  $R^6$ ,  $W$ ,  $Z^1$ ,  $Z^2$  et  $Z^3$  sont définis selon l'une quelconque des revendications 1 à 3.

5. Utilisation de composés de formule générale (I) selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 pour lutter contre des insectes, des araignées et des nématodes, le traitement chirurgical, thérapeutique et diagnostique du corps humain ou animal étant exclu.
6. Compositions pharmaceutiques, contenant au moins un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 4.
7. Composés selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, destinés à une utilisation en tant que médicament.
8. Utilisation de composés selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 pour la fabrication de compositions pharmaceutiques pour lutter contre des parasites sur des animaux.
9. Procédé de fabrication d'agents phytoprotecteurs contenant des composés selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, ainsi que des extendeurs et/ou des substances tensioactives usuels.
10. Procédé de lutte contre des nuisibles, **caractérisé en ce qu'**un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 est laissé agir sur les nuisibles et/ou leur habitat, le traitement chirurgical, thérapeutique et diagnostique du corps humain ou animal étant exclu.
11. Utilisation de composés selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 pour la protection du matériel de reproduction de plantes.
12. Composé 4-bromo-2'-méthyl-4'-(méthylsulfinyl)-5'-(trifluorométhyl)-2'-H-1,3'-bipyrazole.

## IN DER BESCHREIBUNG AUFGEFÜHRTE DOKUMENTE

Diese Liste der vom Anmelder aufgeführten Dokumente wurde ausschließlich zur Information des Lesers aufgenommen und ist nicht Bestandteil des europäischen Patentdokumentes. Sie wurde mit größter Sorgfalt zusammengestellt; das EPA übernimmt jedoch keinerlei Haftung für etwaige Fehler oder Auslassungen.

## In der Beschreibung aufgeführte Patentdokumente

- WO 2004035545 A [0002]
- WO 2004106324 A [0002]
- US 2006069132 A [0002]
- WO 2008029084 A [0002]
- EP 1911751 A [0003]
- WO 2012069366 A [0003] [0097]
- WO 2012080376 A [0003]
- WO 2012107434 A [0003]
- WO 200007980 A [0004]
- WO 2010051926 A [0008] [0180] [0188]
- WO 2005077934 A [0070]
- WO 2007115644 A [0070]
- WO 2007115643 A [0070]
- WO 2007115646 A [0070]
- EP 0539588 A [0070]
- WO 2007149134 A [0070]
- WO 2010074747 A [0070]
- WO 2010074751 A [0070]
- WO 2006089633 A [0070]
- WO 2008067911 A [0070]
- WO 2006043635 A [0070]
- WO 2008066153 A [0070]
- WO 2006056433 A [0070]
- WO 2006100288 A [0070]
- WO 2005035486 A [0070]
- WO 2007057407 A [0070]
- WO 2008104503 A [0070]
- WO 2003106457 A [0070]
- WO 2009049851 A [0070]
- WO 2004099160 A [0070]
- WO 2005063094 A [0070]
- WO 2007040280 A [0070]
- JP 2010018586 A [0070]
- WO 2007075459 A [0070] [0097]
- WO 2005085216 A [0070] [0097]
- WO 2010005692 A [0070]
- WO 2002096882 A [0070]
- WO 2007101369 A [0070]
- WO 2010006713 A [0070]
- WO 2010069502 A [0070] [0112]
- WO 2008009360 A [0070]
- CN 102057925 [0070]
- WO 2011049233 A [0070]
- WO 2012034472 A [0070]
- WO 20092024541 A [0097]
- WO 2012007426 A [0097]
- WO 2012042006 A [0097]
- WO 2012042007 A [0097]
- WO 2012107533 A [0097]
- WO 2012120135 A [0097]
- WO 2012165186 A [0097]
- WO 2012155676 A [0097]
- WO 2012017359 A [0097]
- WO 2012127347 A [0097]
- WO 2012038851 A [0097]
- WO 2012120399 A [0097]
- WO 2012156400 A [0097]
- WO 2012163959 A [0097]
- WO 2011161130 A [0097]
- WO 2011073444 A [0097]
- WO 2011092287 A [0097]
- WO 2011075591 A [0097]
- WO 2011157748 A [0097]
- WO 2007125984 A [0097]
- WO 2009002809 A [0097]
- WO 2011149749 A [0097]
- WO 2009072621 A [0097]
- WO 2010020522 A [0097]
- WO 2009112275 A [0097]
- WO 2009097992 A [0097]
- JP 2008133273 B [0097]
- JP 2007091708 B [0097]
- WO 2012004326 A [0097]
- WO 2012035011 A [0097]
- WO 2012045700 A [0097]
- WO 2010090344 A [0097]
- WO 2010043315 A [0097]
- WO 2008128711 A [0097]
- JP 2008110971 B [0097]
- WO 2012020483 A [0097]
- WO 2012020484 A [0097]
- WO 2012077221 A [0097]
- WO 2012175474 A [0097]
- WO 2011095462 A [0097]
- WO 2011113756 A [0097]
- WO 2011093415 A [0097]
- WO 2005073165 A [0097]
- EP 382173 A [0104]
- US 20120329832 A [0114]
- WO 8910396 A [0135]
- WO 1996033270 A [0140]
- WO 2007024782 A [0140]
- WO 2007027777 A [0143]
- WO 2005040110 A [0177] [0180] [0186]
- WO 2009089508 A [0177] [0180] [0186]
- WO 2007107470 A [0177] [0186]
- WO 2012003405 A [0177] [0186]
- WO 2009158371 A [0177] [0186]

- WO 2010133312 A [0180]
- WO 2012056372 A [0183]
- WO 2003066050 A [0183]
- WO 2008008375 A [0186]
- WO 2012004217 A [0187]
- WO 2009130475 A [0187]
- WO 2008107125 A [0187]
- WO 2003099805 A [0187]
- WO 20120225061 A [0187]
- WO 2009010488 A [0187]
- WO 2011131615 A [0188]
- WO 2006018725 A [0188]
- WO 2012065932 A [0188]
- WO 2007077961 A [0188]
- US 20120115903 A [0188]
- WO 2010017902 A [0188]
- WO 2010127856 A [0188]
- WO 2013092522 A [0240]

#### In der Beschreibung aufgeführte Nicht-Patentliteratur

- *J. Org. Chem.*, 1997, vol. 62 (17), 5908-5919 [0002]
- *J. Heterocycl. Chem.*, 1998, vol. 35 (6), 1493-1499 [0002]
- The Pesticide Manual. British Crop Protection Council, 2006 [0074]
- *Tetrahedron Letters*, 2003, vol. 44, 7629-7632 [0177] [0186]
- *Chemical Reviews*, 1988, vol. 88 (5), 765-792 [0185] [0186]
- *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 2002, vol. 39 (5), 1055-1059 [0186]
- *Tetrahedron Letters*, 2011, 8451-8457 [0188]
- Oxidationsreagenzien. **MIJS, DE JONGE**. Organic Synthesis by Oxidation with Metal Compounds. Plenum Verlag, 1986 [0190]
- **MANGANESE COMPOUNDS AS OXIDIZING AGENTS ; ARNDT**. Organic Chemistry. Open Court Publishing Company, 1981 [0190]
- The Oxidation of Organic Compounds. **LEE**. Permanganate Ion and Hexavalent Chromium. Open Court Publishing Company, 1980 [0190]
- **J. C. COLLINS et al.** *Tetrahedron Lett.*, 1968, vol. 30, 3363-3366 [0190]
- **AUCH R. O. HUTCHINS et al.** *Tetrahedron Lett.*, 1977, vol. 48, 4167-4170 [0190]
- **D. LANDINI et al.** *Synthesis*, 1979, 134-136 [0190]
- Komiya Ruthenium-catalyzed Oxidation of Alkenes, Alcohols, Amines, Amides,  $\beta$ -Lactams, Phenols and Hydrocarbons. **S.-I. MURAHASHI, N.** Modern Oxidation Methods. Wiley-VCH-Verlag GmbH & Co. KGaA, 2004 [0190]
- **J. YAMAWAKI et al.** *Chem. Lett.*, 1983, vol. 3, 379-380 [0190]
- **GREENE T. W. ; WUTS P. G. W.** Protective Groups in Organic Synthesis. John Wiley & Sons, Inc, 1999 [0196]
- **T. L. GILCHRIST**. Comprehensive Organic Synthesis. Pergamon Press, 1992, vol. 7, 748-750 [0201]
- **M. TISLER ; B. STANOVNIK**. Comprehensive Heterocyclic Chemistry. Pergamon Press, 1984, vol. 3, 18-20 [0201]
- **M. R. GRIMMETT ; B. R. T. KEENE**. Advances in Heterocyclic Chemistry. Academic Press, 1988, vol. 43, 149-163 [0201]
- **M. TISLER ; B. STANOVNIK**. Advances in Heterocyclic Chemistry. Academic Press, 1968, vol. 9, 285-291 [0201]
- **G. W. H. CHEESEMAN ; E. S. G. WERSTIUK**. Advances in Heterocyclic Chemistry. Academic Press, 1978, vol. 22, 390-392 [0201]
- *Russian Chemical Bulletin*, 1990, vol. 39 (11), 2338-2344 [0230]
- *European Journal of Organic Chemistry*, 2002, vol. 17, 2913-2920 [0236]