

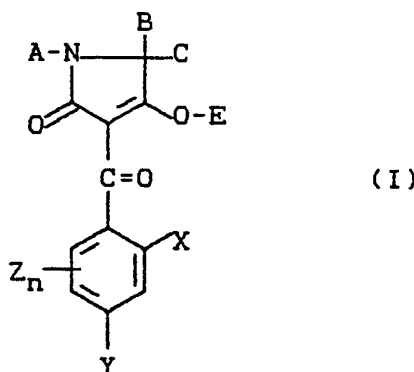


PCT WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

<p>(51) Internationale Patentklassifikation ⁵ : C07D 207/38, 209/54, 471/04 A01N 43/36, 43/38, 43/90 // (C07D 471/04, 221:00, 209:00)</p>	A1	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 94/01401</p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 20. Januar 1994 (20.01.94)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP93/01690</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 30. Juni 1993 (30.06.93)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: P 42 23 015.2 13. Juli 1992 (13.07.92) DE</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Bayerwerk, D-51368 Leverkusen (DE).</p> <p>(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US) : FISCHER, Reiner [DE/DE]; Nelly-Sachs-Strasse 23, D-40789 Monheim (DE). BRETSCHNEIDER, Thomas [DE/DE]; Scheerengasse 7-9, D-53721 Siegburg (DE). SANTEL, Hans-Joachim [DE/DE]; Grünstrasse 9a, D-51371 Leverkusen (DE). LÜRSEN, Klaus [DE/DE]; August-Kierspel-Strasse 145, D-51469 Bergisch-Gladbach (DE). SCHMIDT, Robert, R. [DE/DE]; Im Waldwinkel 110, D-51469 Bergisch-Gladbach (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüscherhof 22, D-42799 Leichlingen (DE).</p>	<p>(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; Bayerwerk, D-51368 Leverkusen (DE).</p> <p>(81) Bestimmungsstaaten: AU, BR, BY, CA, CZ, HU, JP, KR, KZ, NZ, RU, SK, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i></p>	

(54) Title: HERBICIDAL AND INSECTICIDAL 3-BENZOYL-PYRROLIDIN-2,4-DIONE DERIVATES

(54) Bezeichnung: HERBIZIDE UND INSEKTIZIDE 3-BENZOYL-PYRROLIDIN-2,4-DION-DERIVATE



(57) Abstract

New substituted 3-benzoyl-pyrrolidin-2,4-dione derivatives are disclosed having general formula (I), in which A, B, C, E, X, Y, Z and n have the meanings given in the description, as well as several processes for preparing the same, new intermediate products for preparing the same and their use as herbicides, insecticides and acaricides.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I) in welcher A, B, C, E, X, Y, Z und n die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung, neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide, Insektizide und Akarizide.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

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

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

5

10

HERBIZIDE UND INSEKTIZIDE 3-BENZOYL-PYRROLIDIN-2,4-DION-DERIVATE

15 Die Erfindung betrifft neue substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung, neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide, Insektizide und Akarizide.

20

Von 3-Acyl-pyrrolidin-2,4-dionen sind pharmazeutische Eigenschaften vorbeschrieben (S. Suzuki et. al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967), S Toda et al. J. Antibiotics 33, 173 (1980), Reichart Jr. K.L. et al. J. Am. Chem. Soc. 100, 4225 (1978).

25

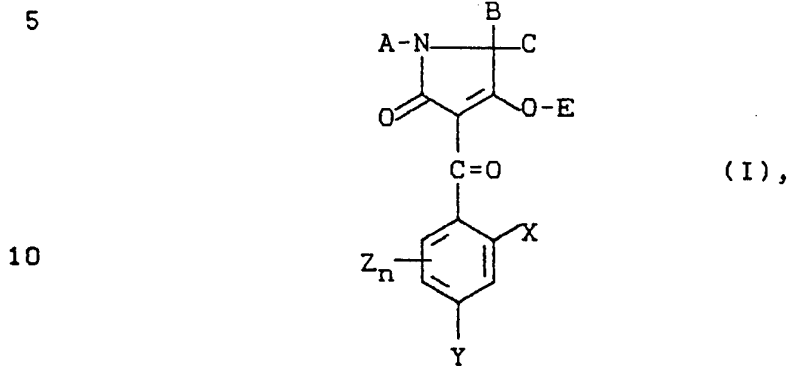
In WO 8804-652 werden 3-Benzoyl-furan-2-on-Derivate mit herbiziden Eigenschaften beschrieben, unter anderem die Verbindung 3-(2,4-Dichlorbenzoyl)-4-hydroxy-6-methyl-N-methyl-pyridon-2.

30

Es wurden nun neue substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gefunden, die durch die Formel (I) dargestellt sind

35

- 2 -



15 in welcher

15

X für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder $-S(O)_m-R^1$ steht,

20

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder $-S(O)_m-R^1$ steht,

25

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkoxy, Alkoxyalkyl oder Alkoxy-carbonyl steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

30

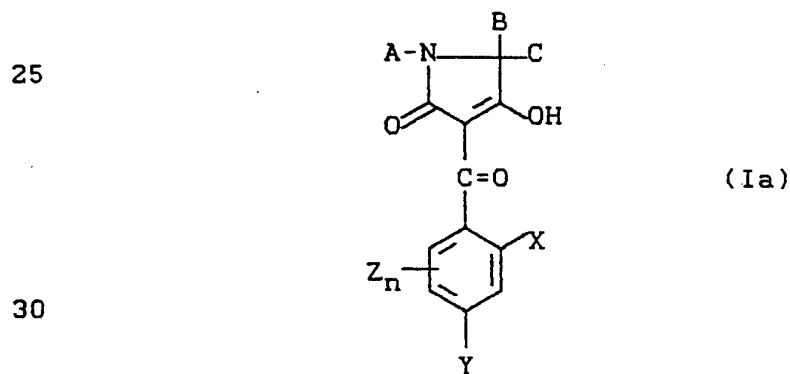
m für eine Zahl von 0-2 steht,

35

A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Alkenyl, Alkynyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogen-

- 5 alkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder Arylalkyl steht,
- B für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl oder gegebenenfalls durch Alkyl, 10 Alkoxy, Halogen, Nitro, Halogenalkyl, substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht,
- C für Wasserstoff, oder gegebenenfalls durch 15 Halogen substituiertes Alkyl steht,
- oder worin
- A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden 20 sind, einen gegebenenfalls durch Halogen oder gegebenenfalls halogeniertes Alkyl oder Alkoxy substituierten gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, 25
- oder worin
- B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie 30 gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Halogen, oder gegebenenfalls durch halogeniertes Alkyl oder Alkoxy substituiert sein kann und durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, 35

- 5 E für Wasserstoff (= E¹), oder für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Aralkyl (= E²), für eine Gruppe CO-R² (= E³) oder für ein Metallion oder Metallequivalent (= E⁴) steht,
- 10 R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder für einen gegebenenfalls substituierten Phenylrest steht und
- 15 R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylthio oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht.
- 20 Weiterhin wurde gefunden, daß man 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) bzw. deren Enole der Formel (Ia)

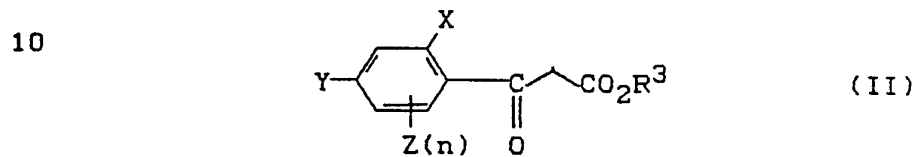


in welcher

- 35 A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 erhält, wenn man

A) Benzoylessigester der Formel (II)

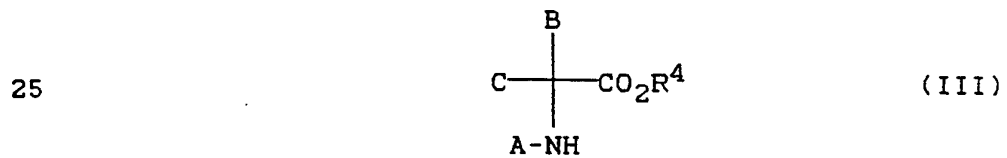


15 in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen
haben und

20 R^3 für Alkyl steht

mit Aminosäureestern der allgemeinen Formel (III)



in welcher

30 A, B und C die oben angegebenen Bedeutungen haben
und

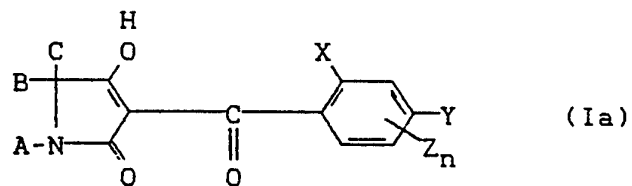
R^4 für Alkyl steht,

35

5
 und in Gegenwart einer Base kondensiert, oder daß
 man

B) Verbindungen der Formel (Ia)

10



15

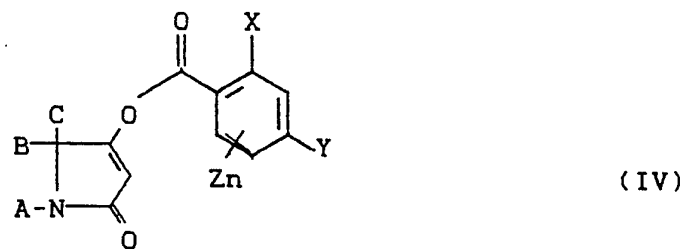
in welcher

A, B, C, X, Y, Z, und n die oben angegebenen
 Bedeutungen haben,

20

erhält, wenn man 4-Benzoyloxy-pyrrolin-2-one der
 Formel (IV)

25



30

35

- 7 -

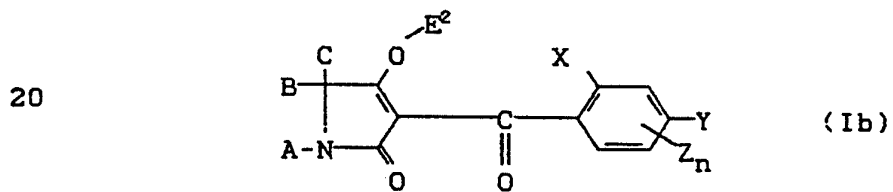
5 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Katalysators umlagert, oder daß man

15

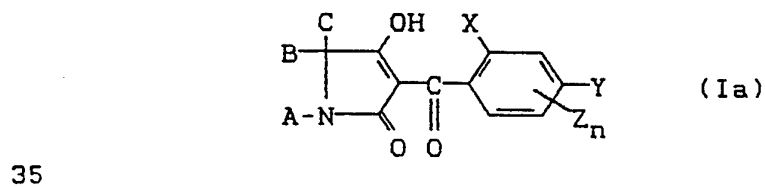
C) Verbindungen der Formel (Ib)



25 in welcher

A, B, C, E², X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

30 erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia),



5 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen
Bedeutungen haben,

10 mit Alkylierungsmitteln der allgemeinen Formel (V)



in welcher

15

E^2 die oben angegebene Bedeutung hat und

L für Halogen, $-OSO_2$ -Alkyl, $-OSO_2O$ -Alkyl oder
 $-OSO_2$ -Aryl steht,

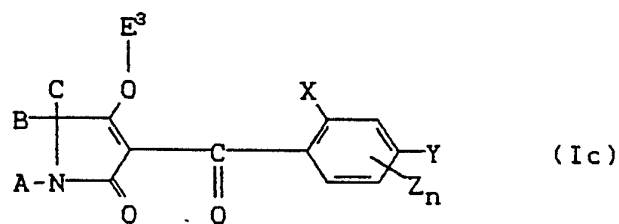
20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer
Base umgesetzt, oder daß man

25

D) Verbindungen der Formel (Ic)

30

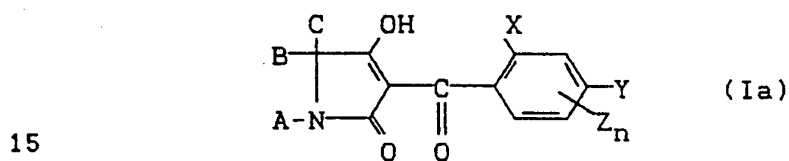


35

5 in welcher

A, B, C, E³, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10 erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia)



in welcher

20 A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit Acylierungsreagenzien der Formel (VI)

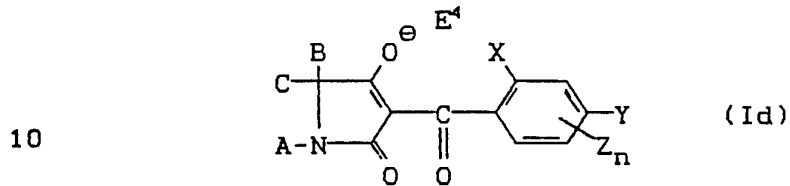


in welcher

30 E³ die oben angegebene Bedeutung hat und
M für Halogen, -OE³, CN, O-SO₂-Alkyl, O-SO₂-Aryl und Imidazolyl steht,

35 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt, oder daß man

5 E) Verbindungen der allgemeinen Formel (Id)



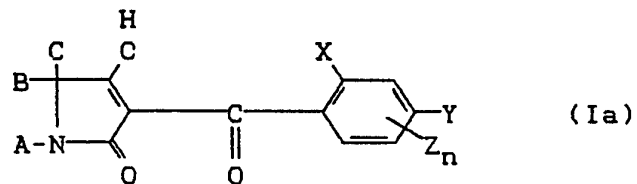
in welcher

15

X, Y, Z, A, B, C, E⁺ und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia)

20



25

in welcher

30

X, Y, Z, A, B, C und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Metallhydroxiden oder Aminen der allgemeinen Formel (VII) und (VIII)

35



- 5 in welchen
- Me für ein- oder zweiwertige Metallionen,
- s und t für die Zahlen 1 und 2 stehen und
- 10 R^4 , R^5 und R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff und Alkyl stehen,
- gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umgesetzt.
- 15
- Überraschenderweise wurde gefunden, daß die neuen 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel I sich durch sehr gute herbizide Wirkungen auszeichnen.
- 20 Bevorzugt sind substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I), in welcher
- X für Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, Halogen, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_6 -Halogenalkoxy, Nitro, C_1-C_6 -Alkoxy-carbonyl, C_1-C_6 -Carboxy, Cyano oder $S(O)_m-R^1$ steht,
- 25
- Y für Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, Halogen, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_6 -Halogenalkoxy, Nitro, C_1-C_6 -Alkoxy-carbonyl, C_1-C_6 -Carboxy, Cyano oder $S(O)_m-R^1$ steht,
- 30
- Z für C_1-C_6 -Alkyl, Halogen, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_6 -Halogenalkoxy, C_1-C_6 -Alkoxy-
- 35

- 12 -

- 5 C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-
C₆-Alkoxy-C₂-C₆-halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl
oder C₁-C₆-Halogenalkoxy-carbonyl steht,
- 10 n für eine Zahl von 0-3 steht,
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- 15 A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen
substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-
C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-
Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl,
C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8
20 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel
unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch
Halogen, C₁-C₆-Alkyl-, C₁-C₆-Haloalkyl-, C₁-C₆-
Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-
C₁-C₆-alkyl steht,
- 25 B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-
Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkyl-C₁-C₈-
thioalkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch
Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein
30 kann, oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-
Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Nitro
substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,
- C für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen
substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl steht, oder worin
35

5 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden
sind, einen 5 bis 8-gliedrigen gesättigten oder
ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff
und/oder Schwefel unterbrochen und durch gegebene-
10 nenfalls halogeniertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy
oder Halogen substituiert sein kann,

oder worin

15 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie
gebunden sind einen 3 bis 8-gliedrigen gesättigten
oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauer-
stoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch
Halogen oder gegebenenfalls halogeniertes C₁-C₆-
20 Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy substituiert sein kann,

E für E¹ = Wasserstoff,
für E² = C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₈-
Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₃-C₈-Halogenalkenyl, C₃-
C₈-Halogenalkinyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-
25 Halogenalkoxy-C₂-C₆-alkyl, Aryl-C₁-C₆-alkyl,
für E³ = eine Gruppe CO-R² oder
für E⁴ = ein Metallion oder ein Metallequivalent
steht,

30 R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes
C₁-C₈-Alkyl, oder für gegebenenfalls durch Halogen,
Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-
C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkyl,
C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl steht und
35

5 R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes
C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₂-C₈-
Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl oder für gege-
benenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-
Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Phenyl, für
10 gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-
Halogenalkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Aryl-
C₁-C₆-alkyl steht.

15 Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in
welcher

X für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Al-
koxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Carboxy oder
20 S(O)_m-R¹ steht,

Y für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-
Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
Nitro, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder
25 S(O)_m-R¹ steht,

Z für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-
Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-
C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Al-
koxy-C₂-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl oder
30 C₁-C₄-Halogenalkoxy-carbonyl steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

35

- 5 m für eine Zahl von 0-2 steht,
- A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen
substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-
C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₁-C₈-
10 Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl,
C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7
Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder
Schwefelatome unterbrochen sein kann oder gegebe-
nenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Halo-
15 alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy oder Nitro substituiertes
Phenyl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,
- B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₀-
20 Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-
C₆-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen das durch
1-2 Sauerstoff und/oder Schwefelatome unterbrochen
sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-
Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Nitro
25 substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,
- C für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen
substituiertes C₁-C₈-Alkyl steht, oder worin
- 30 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden
sind, einen 5 bis 7-gliedrigen gesättigten oder un-

5 gesättigten Cyclus bilden, der durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Fluor oder Chlor substituiert und der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann,

10 oder worin

B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 3 bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch
15 Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiert sein kann,

20 E für E¹ = Wasserstoff
für E² = C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₂-
25 C₄-alkyl, Aryl-C₁-C₄-alkyl,

für E³ = eine Gruppe CO-R² oder

für E⁴ = ein Metallion oder ein Metallequivalent steht,

30

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Halogenalkylthio, C₁-
35

- 5 C₃-Alkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl substituiertes Phenyl,
steht und
- 10 R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-
C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₂-C₆-Al-
kenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl oder für gegeben-
15 falls durch Halogen, C₁-C₅-Halogenalkyl, C₁-C₅-Alkyl
oder C₁-C₅-Alkoxy substituiertes Phenyl, für gege-
benenfalls durch Halogen, C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₅-Halo-
genalkyl oder C₁-C₅-Alkoxy substituiertes Aryl-C₁-
C₄-alkyl steht.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel
(I) in welcher

- 20 X für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl,
Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl,
Difluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Methoxy-
carbonyl, Ethoxycarbonyl, Cyano oder S(O)_mR¹ steht,
- 25 Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl,
Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom,
Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy,
Difluormethyl, Nitro, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbo-
30 nyl, Cyano oder S(O)_mR¹ steht,

- 5 Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-
Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Tri-
fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethoxy,
Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Propoxyethyl, Isoproxy-
ethyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl steht,
10
- n für eine Zahl von 0-3 steht,
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- 15 A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen sub-
stituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-
Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy-
C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₆-
Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ring-
20 atomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwe-
felatome unterbrochen sein kann oder gegebenen-
falls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-,
Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluor-
methyl-, Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-
25 C₃-alkyl steht,
- B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-
Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-
30 C₄-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch
1-2 Sauerstoff und/oder Schwefelatome unterbrochen
sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen,
- 35

5 C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,

10 C für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl steht,

oder worin

15 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, einen 5 bis 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy, Fluor oder Chlor substituiert und der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann,

20

oder worin

25 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an das sie gebunden sind, einen 3 bis 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein kann,

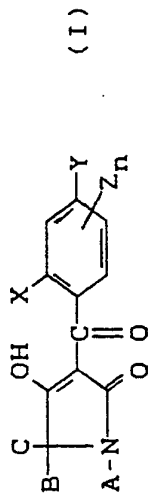
30 E für E¹ = Wasserstoff steht,
für E² = C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₃-Halogenalkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkinyl, C₃-C₄-Halogenal-

35

- 5 kenyl, C₃-C₄-Halogenalkinyl, C₁-C₃-Alk-
oxy-C₂-C₃-alkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy-C₂-
C₃-alkyl, Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,
für E³ = eine Gruppe CO-R² oder
für E⁴ = Li[⊕], Na[⊕], K[⊕], NH₄[⊕] steht,
- 10 R¹ für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₄-
Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor,
Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkoxy, C₁-C₂-Fluoralkoxy,
C₁-C₂-Chloralkoxy, C₁-C₂-Alkylthio, C₁-C₂-Fluor-
15 alkylthio, C₁-C₂-Chloralkylthio, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₂-
Fluoralkyl, C₁-C₂-Difluoralkyl, C₁-C₂-Trifluoralkyl,
C₁-C₂-Chloralkyl, C₁-C₂-Dichloralkyl, C₁-C₂-Tri-
chloralkyl substituiertes Phenyl steht,
- 20 R² für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom
substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-
Alkylthio, C₁-C₄-Alkoxy-(C₂-C₄)alkyl oder für
gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluor-
methyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes
25 Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom,
C₁-C₄-Alkyl, Trifluormethyl oder C₁-C₄-Alkoxy
substituiertes Aryl-C₁-C₂-alkyl steht.

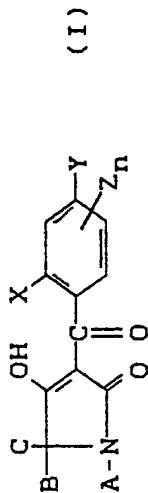
30 Im einzelnen seien außer den bei den Herstellungsbei-
spielen genannten Verbindungen die folgenden substitu-
ierten 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der all-
gemeinen Formel I genannt:

Table 1



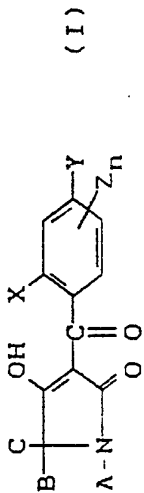
X	Y	Zn	A	B	C
Cl	Cl	H	H	H	H
Cl	Cl	H	H	CH ₃	H
Cl	Cl	H	H	CH(CH ₃) ₂	H
Cl	Cl	H	H	CH ₃	CH ₃
Cl	Cl	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃
Cl	Cl	H	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
Cl	Cl	H	H	C ₃ H ₇	CH ₃
Cl	Cl	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃
Cl	Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -	
Cl	Cl	H	H	-(CH ₂) ₄ -	
Cl	Cl	H	H	-(CH ₂) ₅ -	
Cl	Cl	H	H	C ₂ H ₅	H
Cl	Cl	H	H	C(CH ₃) ₃	H
Cl	Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
Cl	Cl	H	H	CH-C ₂ H ₅ CH ₃	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)



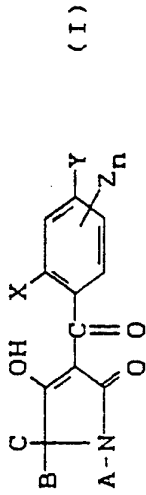
X	Y	Zn	A	B	C
NO ₂	H	H	H	H	H
NO ₂	H	H	H	CH ₃	H
NO ₂	H	H	H	CH(CH ₃) ₂	H
NO ₂	H	H	H	CH ₃	CH ₃
NO ₂	H	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃
NO ₂	H	H	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
NO ₂	H	H	H	C ₃ H ₇	CH ₃
NO ₂	H	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃
NO ₂	H	H	H		-(CH ₂) ₂ -
NO ₂	H	H	H		-(CH ₂) ₄ -
NO ₂	H	H	H		-(CH ₂) ₅ -
NO ₂	H	H	H	C ₂ H ₅	H
NO ₂	H	H	H	C(CH ₃) ₃	H
NO ₂	H	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
NO ₂	H	H	H	CH-C ₂ H ₅	H
				CH ₃	

Table 1 (Fortsetzung)



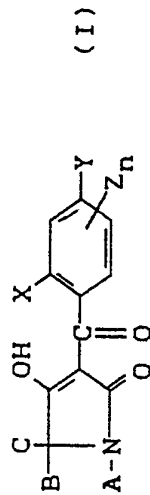
X	Y	Zn	A	B	C
H	NO ₂	H	H	H	H
H	NO ₂	H	H	CH ₃	H
H	NO ₂	H	H	CH(CH ₃) ₂	H
H	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃
H	NO ₂	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃
H	NO ₂	H	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
H	NO ₂	H	H	C ₃ H ₇	CH ₃
H	NO ₂	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃
H	NO ₂	H	H		-(CH ₂) ₂ -
H	NO ₂	H	H		-(CH ₂) ₄ -
H	NO ₂	H	H		-(CH ₂) ₅ -
H	NO ₂	H	H	C ₂ H ₅	H
H	NO ₂	H	H	C(CH ₃) ₃	H
H	NO ₂	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
H	NO ₂	H	H	CH-C ₂ H ₅ CH ₃	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)



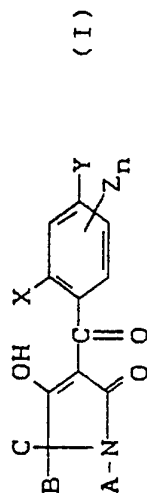
X	Y	Zn	A	B	C
NO ₂	Cl	H	H	H	H
NO ₂	Cl	H	H	CH ₃	H
NO ₂	Cl	H	H	CH(CH ₃) ₂	H
NO ₂	Cl	H	H	CH ₃	CH ₃
NO ₂	Cl	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃
NO ₂	Cl	H	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
NO ₂	Cl	H	H	C ₃ H ₇	CH ₃
NO ₂	Cl	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃
NO ₂	Cl	H	H		-(CH ₂) ₂ -
NO ₂	Cl	H	H		-(CH ₂) ₄ -
NO ₂	Cl	H	H		-(CH ₂) ₅ -
NO ₂	Cl	H	H	C ₂ H ₅	H
NO ₂	Cl	H	H	C(CH ₃) ₃	H
NO ₂	Cl	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
NO ₂	Cl	H	H	CH-C ₂ H ₅	H
				CH ₃	

Tabelle 1 (Fortsetzung)



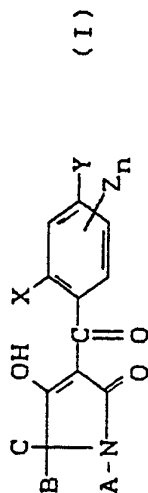
X	Y	Zn	A	B	C
Cl	SO ₂ Me	H	H	H	H
Cl	SO ₂ Me	H	H	CH ₃	H
Cl	SO ₂ Me	H	H	CH(CH ₃) ₂	H
Cl	SO ₂ Me	H	H	CH ₃	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	H	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
Cl	SO ₂ Me	H	H	C ₃ H ₇	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	H	H		-(CH ₂) ₂ -
Cl	SO ₂ Me	H	H		-(CH ₂) ₄ -
Cl	SO ₂ Me	H	H		-(CH ₂) ₅ -
Cl	SO ₂ Me	H	H	C ₂ H ₅	H
Cl	SO ₂ Me	H	H	C(CH ₃) ₃	H
Cl	SO ₂ Me	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
Cl	SO ₂ Me	H	H	CH-C ₂ H ₅	H
				CH ₃	

Tabelle 1 (Fortsetzung)



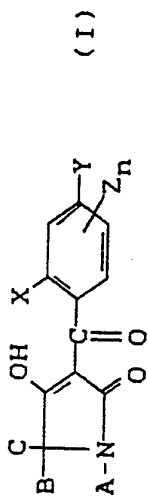
X	Y	Zn	A	B	C
Cl	SO ₂ Me	3-O-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	H	H	H
Cl	SO ₂ Me	"	H	H	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	"	H	CH(CH ₃) ₂	H
Cl	SO ₂ Me	"	H	CH ₃	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	"	H	C ₂ H ₅	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	"	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
Cl	SO ₂ Me	"	H	C ₃ H ₇	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	"	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃
Cl	SO ₂ Me	"	H	-(CH ₂) ₂	
Cl	SO ₂ Me	"	H	-(CH ₂) ₄	
Cl	SO ₂ Me	"	H	-(CH ₂) ₅	
Cl	SO ₂ Me	"	H	C ₂ H ₅	H
Cl	SO ₂ Me	"	H	C(CH ₃) ₃	H
Cl	SO ₂ Me	"	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
Cl	SO ₂ Me	"	H	CH-C ₂ H ₅	H
				CH ₃	

Tabelle 1 (Fortsetzung)



X	Y	Zn	A	B	C
Cl	Cl	H	CH ₃	H	H
Cl	Cl	H	CH(CH ₃) ₂	H	H
Cl	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H
Cl	Cl	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H
Cl	Cl	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
Cl	Cl	H	C ₃ H ₇	CH ₃	H
Cl	Cl	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
Cl	Cl	H		-(CH ₂) ₄ -	H
Cl	Cl	H		-(CH ₂) ₅ -	H
Cl	Cl	H	C ₂ H ₅	H	H
Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₃	H	H
Cl	Cl	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H
Cl	Cl	H	CH-C ₂ H ₅ CH ₃	H	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)

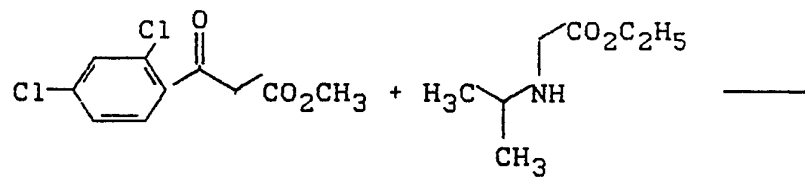


X	Y	Zn	A	B	C
Cl	Cl	H	Cyc. -C ₃ H ₅	H	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C ₃ H ₅	CH ₃	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C ₅ H ₉	H	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C ₅ H ₉	CH ₃	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C ₆ C ₁₁	H	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C ₆ H ₁₁	CH ₃	H
Cl	Cl	H	Phenyl	H	H
Cl	Cl	H	Phenyl	CH ₃	H
Cl	Cl	H	Benzyl	H	H
Cl	Cl	H	Benzyl	CH ₃	H
Cl	Cl	H	CH ₂ =CHCH ₂	H	H
Cl	Cl	H	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₃	H
Cl	Cl	H	CH ₃	Benzyl	H
Cl	Cl	H	CH ₃	Phenyl	H

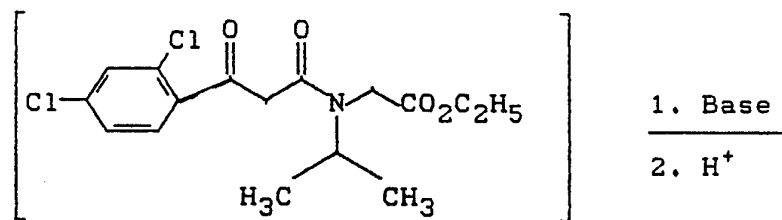
5

Verwendet man gemäß Verfahren (A) 2,4-Dichlor-benzoyl-essigsäure-methylester und N-Isopropyl-glycin-ethylester als Ausgangsstoffe und Natriumethylat als Base, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

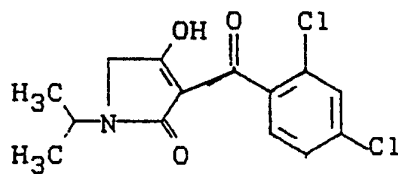
10



15



20

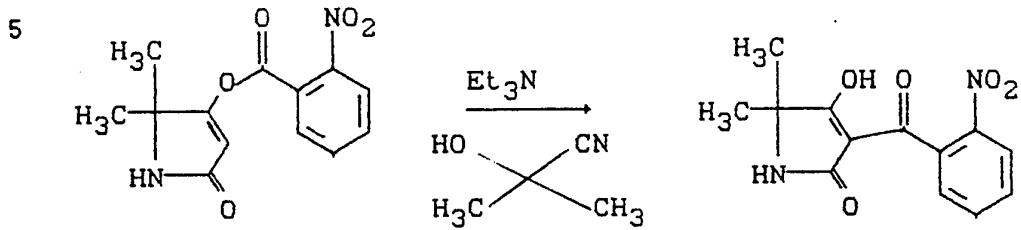


25

Verwendet man gemäß Verfahren (B) 4-(2-Nitrobenzoyloxy)-5,5-dimethyl-pyrrolin-2-on, Triethylamin als Base und Acetoncyanhydrin als Katalysator (EP 186 117), so kann das erfindungsgemäße Verfahren durch folgendes Reaktionsschema beschrieben werden:

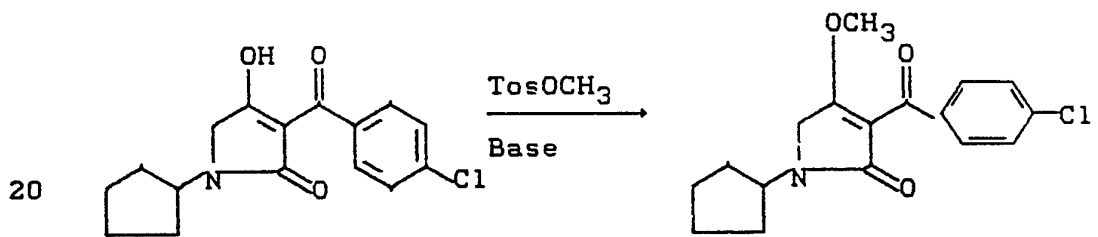
30

35



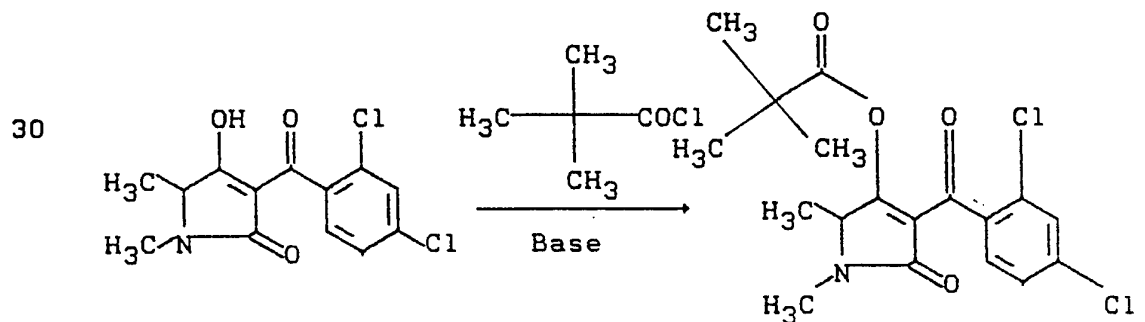
Verwendet man gemäß Verfahren (C) 3-(4-Chlorbenzoyl)-1-cyclopentanyl-pyrrolidin-2,4-dion und Toluolsulfonsäuremethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

15

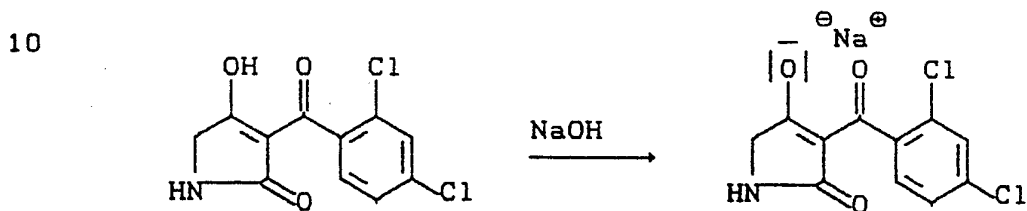


Verwendet man gemäß Verfahren (D) 1,5-Dimethyl-3-(2,4-dichlorbenzoyl)-pyrrolidin-2,4-dion und Pivaloylchlorid, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

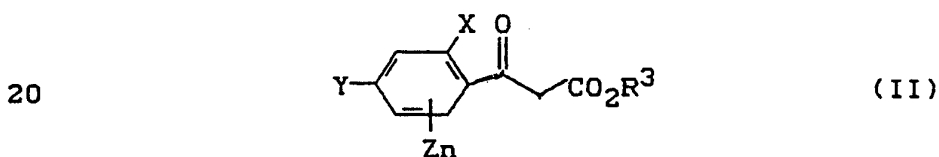
25



5 Verwendet man gemäß Verfahren (E) 3-(2,4-Dichlor-
benzoyl)-pyrrolidin-2,4-dion und Natriumhydroxid, so
kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch
folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



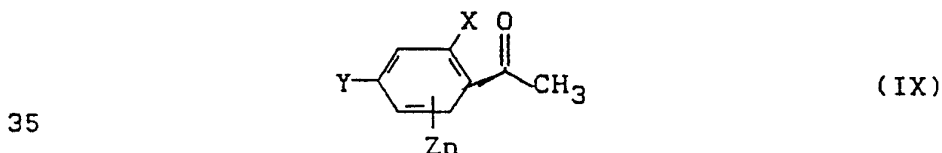
15 Die bei dem obigen Verfahren (A) als Ausgangsstoffe be-
nötigten Verbindungen der Formel II



in welcher

25 R^3 , X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen
haben,

sind teilweise bekannt oder lassen sich nach bekannten
Methoden in einfacher Weise herstellen. So erhält man
30 z.B. Benzoylessigester der Formel (II), wenn man
Acetophenone der Formel (IX)



- 32 -

5 in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Alkylcarbonaten der Formel (X)

10



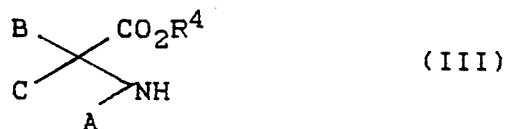
in welcher

15 R^3 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart von Basen kondensiert (Brändström, A., Acta
chem. scand. 4, 1315 (1950).

20 Die bei dem obigen Verfahren (A) als Ausgangsstoffe wei-
terhin benötigten Verbindungen der Formel (III)

25



in welcher

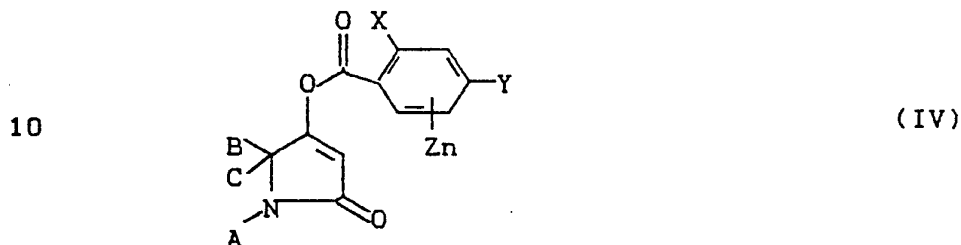
30 A, B, C und R^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

sind teilweise bekannt oder lassen sich nach bekannten
Verfahren, wie sie in der Literatur beschrieben werden,
herstellen, wenn man z.B. α -Halogencarbonsäuren bzw.

35

-ester mit Aminen umgesetzt (Advanced Organic Chemistry,
J. March, S, 377 (Mc Graw-Hill Inc. 1977).

5 Die bei dem obigen Verfahren (B) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (IV)



15 in welcher

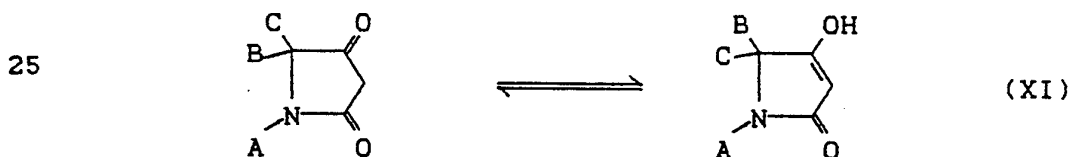
15

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20 sind neu und sind ebenfalls Teil des Anspruchs.

20

Die Verbindungen (IV) erhält man, wenn man Verbindungen der Formel (XI)



30 in welcher

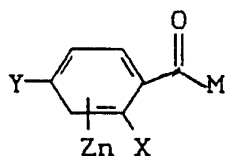
30

A, B und C die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Benzoylverbindungen der Formel (XII)

35

5



(XII)

10

in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen
haben,

15

und M für Halogen oder Cyano steht

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls
in Gegenwart eine Base umgesetzt.

20

Die Verbindungen (XI) sind teilweise bekannt oder
lassen sich nach literaturbekannten Verfahren her-
stellen, z.B. Matsuo, Tanaka; Chem. Pharm. Bull. 32,
3724 (1984); Noland, Sundberg, J. Org. Chem. 28, 3150,
25 (1963).

Verbindungen der Formel (XII) sind teilweise käuflich,
oder sind nach allgemein bekannten Literaturverfahren
einfach herzustellen.

30

Das Verfahren (A) ist dadurch gekennzeichnet, daß man
Verbindungen der Formel (II), in welcher X, Y, Z, n und
R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Amino-
säureester der Formel (III), in welcher A, B, C und R⁴
35 die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Substanz oder
in Gegenwart eines Lösungsmittels umgesetzt und die dabei
erhaltenen Verbindungen mit einer Base kondensiert.

- 5 Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen
Verfahren (A) alle üblichen inerten organischen Solven-
tien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind
Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol, Dekalin,
Tetralin, Mesitylen, Triisopropylbenzol, ferner Ether,
10 wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glykoldi-
methylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare
Lö-sungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Di-
methylformamid und N-Methyl-pyrrolidon.
- 15 Als Deprotonierungsmittel können bei der Durchführung
des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen
Protonenakzeptoren eingesetzt werden. Vorzugsweise ver-
wendbar sind Alkalimetall- und Erdalkalimetall-oxide,
-hydroxide und -carbonate, wie Natriumhydroxid, Kalium-
20 hydroxid, Magnesiumoxid, Calciumoxid, Natriumcarbonat,
Kaliumcarbonat und Calciumcarboat, die auch in Gegenwart
von Phasentransferkatalysatoren wie z.B. Triethyl-
benzylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Adogen
464 und TDA 1 eingesetzt werden können. Ferner sind
25 Alkalimetall- und Erdalkalimetallamide und -hydride, wie
Natriumamid, Natriumhydrid und Calciumhydrid, und außer-
dem auch Alkalimetall-alkoholate, wie Natrium-methylat,
Natriummethylat und Kalium-tert.-butylat einsetzbar.

30

-
- 35 Adogen 464 = Methyltrialkyl(C₈-C₁₀)ammoniumchlorid
TDA 1 = Tris-(methoxyethoxyethyl)-amin

5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung
des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) innerhalb eines
größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen ar-
beitet man bei Temperaturen zwischen 0° C und 250° C,
vorzugsweise zwischen 50° C und 200° C.

10

Das erfindungsgemäße Verfahren (A) wird im allgemeinen
unter Normaldruck durchgeführt.

15

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
(A) setzt man die Reaktionskomponenten der Formeln (II)
und (III) und die deprotonierenden Basen im allgemeinen
in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch mög-
lich, die eine oder andere Komponente in einem größeren
Überschuß (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

20

Das Verfahren (B) ist dadurch gekennzeichnet, daß Enol-
ester der Formel (IV), in welcher A, B, C, X, Y, Z und
n die oben angegebenen Bedeutungen haben in Gegenwart
eines Lösungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart einer
25 Base und in Gegenwart eines geeigneten Katalysators
umgelagert werden.

30

Als Katalysator sind vorzugsweise verwendbar, z.B.
Lewissäuren wie $ZnCl_2$, $AlCl_3$, BF_3 -Etherat, Ti^{4+} -Salze
etc., sowie Acylierungskatalysatoren wie z.B. 4-N,N-Di-
methylaminopyridin oder 4-Pyrrolidino-pyridin, wie auch
Verbindungen die prinzipiell Cyanid abspalten können.

35

- 5 Cyanid-abspaltende Reagenzien sind Verbindungen, die während der Reaktion Cyanwasserstoff und/oder Cyanid-Anionen abspalten.
- 10 Zwei Verfahrensvarianten sind dabei möglich. Bei der einen wird das Verfahren in Gegenwart katalytischer Mengen des Cyanid- oder Cyanwasserstoff-abspaltenden Reagens zusammen mit einem molaren Überschuß einer milden Base durchgeführt.
- 15 Bevorzugte Cyanid-abspaltende Reagenzien sind Alkali-cyanide wie Natrium- und Kaliumcyanid; Cyanhydrine von methyl-alkyl-Ketonen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylrest wie Aceton- oder Methylisobutylketon-cyanhydrin; Cyanhydrine des Benzaldehyd oder C₂-C₅-Alkyl
- 20 substituierter Aldehyde wie Acetaldehyd, Propionaldehyd, Zinkcyanid, tri(nieder-Alkyl)silylcyanid wie Trimethylsilylcyanid und Cyanwasserstoff. Zu bevorzugen ist Cyanwasserstoff, da es sehr schnell reagiert und kostengünstig ist. Desweiteren kann es in flüssiger Form oder
- 25 gasförmig eingesetzt werden. Wird es als Gas eingesetzt, kann es aus einer Vorratsflasche oder durch Reaktion einer Säure mit einem Metallcyanid gewonnen werden. Unter den Cyanhydrinen wird Aceton-cyanhydrin bevorzugt.
- 30 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) wird das Cyanid-liefernde Reagens in einer Konzentration von 1 bis 50 Mol-% in Bezug auf der Enolester eingesetzt. Bevorzugt werden 1-10 Mol-%.
- 35

5 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
(B) wird ein Überschuß an milder Base in Bezug auf den
Enolester eingesetzt. Mit milder Base bezeichnet man
Basen deren Basizität zwischen starken Basen wie Alkali-
hydroxidlösungen (die im vorliegenden Fall Hydrolyse des
10 Enolesters zur Folge hätten) und schwacher Base wie Al-
kalibicarbonate (die im vorliegenden Fall keine Reaktion
zur Folge hätten) liegen. Zu den milden Basen gehören
organische Basen wie tertiäre Amine und anorganische
Basen wie Alkalimetallcarbonate und Alkalimetallphos-
15 phate. Bevorzugt organische Basen sind Trialkylamine wie
Triethylamin oder Trialkanolamine wie Triethanolamin und
Pyridin.

Bevorzugte anorganische Basen sind Kaliumcarbonat und
20 Trinatriumphosphat.

Die Base wird in einer Konzentration zwischen 1 und 4
Mol pro Mol Enolester eingesetzt, bevorzugt in einer
25 Konzentration von 2 Mol.

Ist das Cyanid-abspaltende Reagens ein Alkalicyanid,
z.B. Kaliumcyanid, kann ein Phasen-transfer-Katalysator
zugesetzt werden. Bevorzugt werden Kronenether einge-
30 setzt. Als gegebenenfalls eingesetzte Verdünnungsmittel
kommen nur Lösungsmittel in Frage, die mit dem Säure-
chlorid oder dem acylierten Produkt keine Reaktion
eingehen. Bevorzugt wird 1,2-Dichlorethan eingesetzt.
Weitere mögliche Verdünnungsmittel je nach Reaktanden
oder Produkte sind Toluol, Acetonitril, Methylenchlorid,
35 Ethylenacetat, Dimethylformamid und Methylisobutyl-
keton.

5 Das Herstellungsverfahren (B) wird in Abhängigkeit vom
Cyanid-liefernden Reagens und der Reaktanten bei einer
Temperatur von 80° C durchgeführt. In einigen Fällen,
wenn zum Beispiel viel Nebenprodukte entstehen, was bei
Einsatz von Ortho-Cyanobenzoylhalogenid und Alkalime-
10 tallcyanid oder Aceton-cyanhydrin auftreten kann, sollte
die Reaktionstemperatur bei 40° C ihr Maximum haben.

In der zweiten Verfahrensvariante des Herstellungsver-
fahrens (B) dient Kalium oder Lithiumcyanid als Cyanid-
15 Quelle, die ohne Einsatz einer zusätzlichen Base jedoch
in stöchiometrischer Menge eingesetzt wird. Hinzugefügt
wird nur noch eine katalytische Menge an Phasentrans-
ferkatalysator, in der Regel ein Kronenether oder ein
acyclisches Analogon. Bevorzugter Kronenether ist
20 18 Krone 6. Andere hexadentale Reagenzien wie Cyclo-
hexyl-18-Krone-6, Dibenzo-18-Krone-6, und acyclische
Verbindungen wie Pentaethylenglycoldimethylether können
ebenfalls verwendet werden.

25 Für Lithiumcyanid empfiehlt sich 15-Krone-5 als Phasen-
transferkatalysator.

Diese zweite Verfahrensvariante ist zu bevorzugen für
die Herstellung von Verbindungen der Formel (I), insbe-
30 sondere wenn unter milden Reaktionsbedingungen verfahren
werden muß und Nebenprodukte zu vermeiden sind, wie sie
z.B. bei der Reaktion mit ortho-cyanophenyl-substituier-
ten benzoylierten Cyclohexandionen bekannt sind. Diese

35

5 zweite Verfahrensvariante des Herstellungsverfahrens (B) wird bei Raumtemperatur durchgeführt. Die verwendeten Verdünnungsmittel entsprechen denen, wie sie in der ersten Verfahrensvariante des Verfahrens (B) verwendet werden, wobei Acetonitril bevorzugt wird.

10

Beide Verfahrensvarianten des Herstellungsverfahrens (B) werden mit dem Enol-Ester der Formel (IV) als Ausgangssubstanz durchgeführt.

15

Der Enolester kann aber auch in situ hergestellt werden, zum Beispiel durch Reaktion des Acylierungsreagens mit einem Diketon, wobei mit Enolester der Enolester einer Carbonsäure gemeint ist. Wird der Enolester als Ausgangssubstanz in beiden Verfahrensvarianten vorgelegt, so kann er zuvor nach literaturbekannten Verfahren hergestellt werden z.B. durch Acylierung einer β -Dicarbonylverbindung mit Säurehalogeniden.

20

25

Die Synthese der acylierten Pyrrolidin-2,4-dione nach dem Herstellungsverfahren (B), beginnend mit dem Acylierungsreagens und Pyrrolidindion (z.B. Säurehalogenid wie Benzoylchlorid und Pyrrolidindion) kann mit oder ohne Isolierung des intermediär gebildeten Enolesters erfolgen.

30

Im ersten Fall läßt man das Säurehalogenid oder ein anderes acylierendes Reagens und das Pyrrolidindion in Gegenwart einer milden Base wie Triethylamin reagieren. Der daraus anfallende Enolester kann durch bekannte

35

5 Methoden aus der organischen Chemie isoliert werden.
Diese Verfahrensweise empfiehlt sich dann, wenn im
zweiten Reaktionsschritt ein anderes Lösungsmittel
eingesetzt wird, um den Enolester in ein acyliertes
Diketon umzulagern. Der getrocknete Enolester wird dazu
10 in einem geeigneten Lösungsmittel wie Acetonitril- oder
1,2-Dichlorethan gelöst und mit dem Cyanid-liefernden
Reagens der Wahl und einer schwachen Base oder einem
Kronenether versetzt. Die Reaktionstemperatur richtet
sich dabei nach der Verfahrensvariante.

15

Als Alternative steht die Eintopfvariante zur Verfügung,
wobei der Enolester im Reaktionsmedium verbleibt und
direkt in der zweiten Stufe in demselben Lösungsmittel
mit dem Cyanid-liefernden Reagens und gegebenenfalls
20 einer Base versetzt wird.

In einer weiteren Verfahrensvariante erhält man das
acylierte Pyrrolidindion in einer Einstufenreaktion durch
in situ Synthese und Umlagerung des Enolesters, indem
25 man das Säurehalogenid oder andere acylierende Reagen-
zien mit Pyrrolidindionen in Gegenwart geeigneter Mengen
Cyanid-liefernden Reagens' und milder Base oder
Kronenether umsetzt, je nachdem, welches
Herstellungsverfahren herangezogen wird.

30

Man erhält bei beiden Verfahrensvarianten, d.h. mit oder
ohne Isolierung der Enolester, vergleichbare Ausbeuten.

35

5 Das acylierte Pyrrolidindion erhält man durch dieses
Herstellungsverfahren (B) in Form seines Salzes, woraus
es durch Ansäuern und Extraktion mit einem geeigneten
Lösungsmittel freigesetzt werden kann. In einigen Fällen
10 kann das Produkt durch geringe Mengen Carbonsäure, ent-
standen aus dem Carbonsäurechlorid, verunreinigt sein.
Diese Verunreinigungen entfernt man durch Versetzen des
sauren Produkts mit wäßriger Natriumhydroxyd-Lösung oder
anderer geeigneter Basen, um die Säure als Salz abzu-
trennen. In der zweiten Verfahrensvariante des Herstel-
15 lungsverfahrens erhält man das acylierte Pyrrolidindion
direkt in reiner Form.

Das Verfahren (C) ist dadurch gekennzeichnet, daß man
Verbindungen der Formel (Ia) mit Alkylierungsreagenzien
20 der Formel (V) gegebenenfalls in Gegenwart eines Ver-
dünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines
Säurebindemittels umsetzt. Die Verbindungen der Formel
(I) sind erfindungsgemäße Verbindungen und nach dem oben
beschriebenen Verfahren erhältlich.

25 Die weiterhin als Ausgangsstoffe zur Herstellung der er-
findungsgemäßen Verbindungen (Ib) als Ausgangsstoffe be-
nötigten Alkylierungsmittel sind durch die Formel (V)
allgemein definiert.

30 In der Formel (V) steht E² vorzugsweise für die in den
Vorzugsbereichen angegebenen Bedeutungen, ganz besonders
bevorzugt für Methyl, Ethyl, Propyl oder iso-Propyl,

35

5 Allyl, Propinyl und durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy
oder Trifluormethyl substituiertes Benzyl. In der Formel
(V) steht L bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, C₁-C₄-
Alkylsulfonyloxy, C₁-C₄-Alkoxy sulfonyloxy oder p-Toluol-
10 sulfonyloxy, wie beispielsweise Methansulfonyloxy, Meth-
oxysulfonyloxy oder Ethoxysulfonyloxy.

Die Alkylierungsreagenzien der Formel (V) sind bekannte
Verbindungen der organischen Chemie.

15 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C)
zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen (Ib)
kommen als Verdünnungsmittel inerte organische Lösungs-
mittel in Frage. Vorzugsweise verwendet man alipha-
tische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls
20 halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise
Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Pentan, Hexan, Heptan
Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Methylenchlorid,
Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol oder
Dichlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Diisopropyl-
25 ether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldi-
ethylether oder -dimethylether, Ketone wie Aceton,
Butanon, Methylisopropylketon oder Methylisobutylketon,
Ester, wie Essigsäureethylester, Säuren, wie Essigsäure,
Nitrile, wie Acetonitril oder Propionitril, Amide, wie
30 Dimethylformamid, Dimethylacetamid, N-Methyl-pyrrolidon
oder Hexamethylphosphorsäuretriamid. Verwendet man als
Reaktionspartner Verbindungen der Formel (V) in flüssi-

35

5 ger Form, so ist es auch möglich, diese in entsprechendem Überschuß gleichzeitig als Verdünnungsmittel einzusetzen.

10 Als Säurebindemittel kommen alle üblicherweise verwendbaren anorganischen und organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendet man Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriumhydroxid, Natriumcarbonat oder Natriumhydrogencarbonat, oder auch
15 tertiäre Amine, wie beispielsweise Triethylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, 4-(N,N-Dimethylamino)-pyridin, Diazoabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

20 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen -20°C und $+150^{\circ}\text{C}$, vorzugsweise zwischen 0°C und $+100^{\circ}\text{C}$.

25 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen (Ib) setzt man pro Mol an Verbindungen der Formel (Ia) im allgemeinen jeweils 1 bis 20 Mol, vorzugsweise jeweils 1 bis 15 Mol, Alkylierungsmittel der Formel (V) und gegebenenfalls 1 bis 3 Mol, vorzugsweise 1 bis 2 Mol
30 Säurebindemittel ein. Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte der Formel (Ib) erfolgt nach den in der organischen Chemie üblichen Methoden.

35

5 Das erfindungsgemäße Verfahren (D) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (Ia) mit Acylierungsreagenzien der Formel (VI) umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen
10 Verfahren (D) alle inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüber hinaus Carbonsäureester wie Essigsäureethylester oder Solventien, wie Dimethylsulfoxid und Sulfolan. Wenn die Hydrolysestabilität des
15 Acylierungsreagens es zuläßt, kann die Umsetzung auch in Gegenwart von Wasser durchgeführt werden.
20

Als Säurebindemittel kommen bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (D) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind
25 tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicycloundecen (DBU), Diazabicyclononen (DBN), Hünig-Base und N,N-Dimethylanilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calciumoxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie
30 Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (D) innerhalb eines größeren
35

5 Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und $+150^{\circ}\text{C}$, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
10 (D) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und das Acylierungsreagens der Formel (VI) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Acylierungsreagens in einem größeren
Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung
15 erfolgt nach üblichen Methoden.

Das erfindungsgemäße Verfahren (E) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (Ia) mit
20 Metallhydroxiden (VII) oder Aminen (VIII) umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen
Verfahren (E) vorzugsweise Ether wie Tetrahydrofuran,
Dioxan, Diethylether, Nitrile oder Acetonitril oder aber
Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, aber auch
25 Wasser eingesetzt werden. Das erfindungsgemäße Verfahren (E) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Die Reaktionstemperaturen liegen im allgemeinen zwischen
 -20°C und 100°C , vorzugsweise zwischen 0°C und 50°C .

30 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) bzw. (VII) oder (VIII) im allgemeinen in angenähert äquimolaren
Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, die eine
oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis
35 zu 2 Mol) einzusetzen. Im allgemeinen geht man so vor, daß man das Reaktionsgemisch durch Entfernen des Verdünnungsmittels im Vakuum einengt.

5 Die Aufarbeitung erfolgt wiederum nach üblichen Methoden.

Die Wirkstoffe eignen sich zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, vorzugsweise Arthropoden und Nematoden,
10 insbesondere Insekten und Spinnentieren, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den
15 oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

20 Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spec.*

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera immaculata*.

25 Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.
Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.
Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Blatta orientalis*,
Periplaneta americana, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*,
30 *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

35

- 5 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp.,
Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Phylloxera vastatrix*,
Pemphigus spp., *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus*
spp., *Linognathus* spp.
- 10 Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. *Trichodectes* spp.,
Damalinea spp.
Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips*
femoralis, *Thrips tabaci*.
Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp.,
- 15 *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*,
Rhodnius prolixus, *Triatoma* spp.
- Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*,
Bemisia tabaci, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*,
20 *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*,
Doralis pomi, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*,
Macrosiphum avenae, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*,
Rhopalosiphum padi, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*,
Nephotettix cincticeps, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*,
25 *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*,
Aonidiella aurantii, *Aspidiotus hederiae*, *Pseudococcus*
spp. *Psylla* spp.
- Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*,
Bupalus piniarius, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis*
30 *blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*,
Malacosoma neustria, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp.,
Bucculatrix thurberiella, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp.,
Euxoa spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp.,
Spodoptera exigua,
- 35 *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*,

5 Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella,
 Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia
 kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella,
 Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Ca-
 coecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumi-
 10 ferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix
 viridana.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum,
 Rhizophorthera dominica, Acanthoscelides obtectus, Acan-
 15 thoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica
 alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae,
 Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna
 varive stis, Atomaria spp., Oryzaeophilus surinamensis,
 Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sul-
 20 catus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis,
 Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthre-
 nus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aene-
 us, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides,
 Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Cono-
 25 derus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solsti-
 tialis, Costelytra zealandica.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hop-
 locampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa
 spp.

30 Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles
 spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp.,
 Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp.,
 Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyp-
 pobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma
 35

- 5 spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*.
- 10 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..
Aus der Ordnung der Arachnida z.B. *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.
- 15 Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp..
- 20 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zeichnen sich durch eine hohe insektizide Wirksamkeit aus.
- 25 Sie lassen sich mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Insekten, wie beispielsweise gegen die Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*) oder gegen die Larven der Kohlschabe (*Plutella maculipennis*) einsetzen.
- 30 Darüber hinaus zeigen die erfindungsgemäßen Wirkstoffe auch akarizide Wirksamkeit.
- 35

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

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

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

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

30 Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria,
Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine,
Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum,
Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagitta-

35

5 ria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Spheno-
clea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

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

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist je-
doch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern
erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflan-
15 zen.

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

Die erfindungsgemäßen Verbindungen eignen sich zur se-
lektiven Bekämpfung von mono- und dikotylen Unkräutern
30 in monokotylen Kulturen im Vor- und Nachauflaufverfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen
überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpul-
ver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lös-
35 liche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzen-
trate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische
Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

5 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln
10 und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische
15 Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel,
20 wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:
z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit,
30 Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und
35 organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Mate-

5 rial wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Ta-
bakstengeln; als Emulgier- und/oder schäumerzeugende
Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anioni-
sche Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester,
10 Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-poly-
glykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate
sowie Einweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in
Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

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

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

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1
und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und
30 90 %.

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

- 5 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.
- 10 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üb-
- 15 licher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden.

20 Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art

25 des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 0,01 und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 0,05 und 5 kg pro ha.

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

35

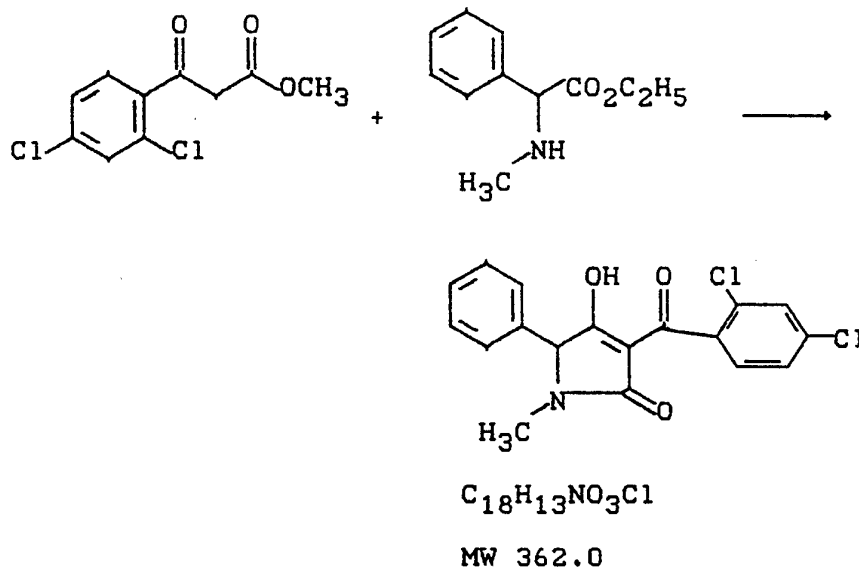
5 HerstellungsbeispieleBeispiel 1

Verfahren A

10

15

20



25 12,36 g (50 mmol) Methoxycarbonyl-2,4-dichloroaceto-
 phenon und 9,6 g (50 mmol) N-Methylamino-phenylessig-
 säureethylester werden in 50 ml absolutem Xylol 12 Stun-
 30 den bei 120-125° C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird
 dann in eine Lösung von 3,75 g Natriumethylat (55 mmol)
 in 40 ml absolutem Ethanol eingetropt und 4 Stunden bei
 70° C gerührt.

35

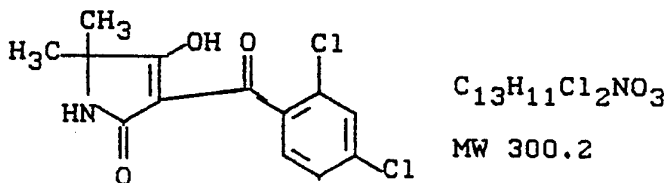
5 Danach nimmt man die Lösung in einen Gemisch aus
 Methylchlorid und 1 normaler Salzsäure auf, extra-
 10 hiert, trennt die wäßrige Phase ab und wiederholt den
 Vorgang mit Natriumhydrogencarbonat-Lösung. Nach Trennen
 der beiden Phasen voneinander säuert man die wäßrige
 15 Phase an, wobei ein klebriger Niederschlag ausfällt, der
 mit Methylchlorid aufgenommen wird. Das Lösungsmittel
 wird im Vakuum entfernt und man erhält 9,98 g (55 % der
 Theorie). 3-(2,4-Dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-phenyl-
 pyrrolidin-2,4-dion mit Schmelzpunkt 137-138°C.

15

Beispiel 2

nach Verfahren B

20



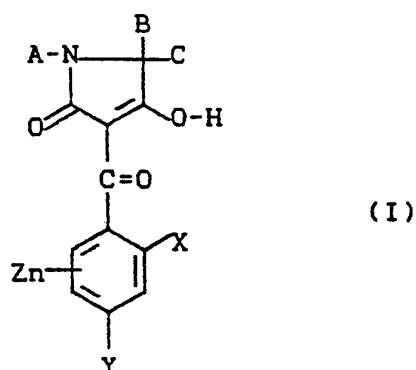
25 2,4 g (8 mmol) 4-(2,4-Dichlor-benzoyloxy)-5,5-dimethyl-
 1H-pyrrolin-2-on werden in 40 ml absolutem Acetonitril
 vorgelegt und mit 2,24 ml (16 mmol) Triethylamin und
 0,18 ml (2 mmol) Hydroxyisobuttersäurenitril bei Raum-
 30 temperatur zur Reaktion gebracht. Nach Beendigung der
 Reaktion, was durch Dünnschichtchromatographie festge-
 stellt wird, rührt man das Reaktionsgemisch in 100 ml

35

5 1 normaler HCl ein, filtriert den dabei anfallenden Niederschlag ab, trocknet und erhält 1,9 g (79 % der Theorie) 3-(2,4-Dichlorbenzoyl)-5,5-dimethyl-1H-pyrrolidin-2,4-dion vom Schmelzpunkt 144-146° C.

10 In analoger Weise zu Beispiel 1 und unter Berücksichtigung der Angaben in der Beschreibung zu den erfindungsgemäßen Verfahren, werden die nachfolgend in Tabelle 2 aufgeführten Endprodukte der Formel (I) erhalten.

15



25

Tabelle 2

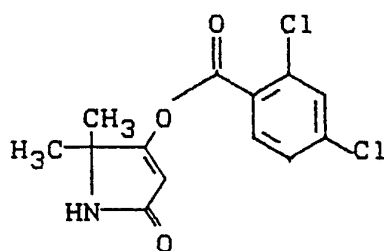
Präparat- Nummer	A	B	C	X	Y	Zn	Fp. [° C]
3	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	H	H	182
4	CH ₃	CH ₃	H	Cl	Cl	H	99-100
30 5	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	H	Cl	Cl	H	Öl
6	i-C ₃ H ₇	H	H	Cl	Cl	H	99-100
7	cyclo-C ₅ H ₉	H	H	Cl	Cl	H	96-97
8	cyclo-C ₅ H ₉	CH ₃	H	Cl	Cl	H	98-99
9	C ₆ H ₇	CH ₃	H	Cl	Cl	H	158-159
10	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	H	H	Cl	Cl	H	82-84
11	-(CH ₂) ₄	-	H	Cl	Cl	H	107-108
35 12	H	CH ₃	CH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	O-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	Harz
13	CH ₃	H	H	Cl	Cl	H	125 (Zers.)
14	CH ₃	C ₂ H ₅	H	Cl	Cl	H	Öl

5 Tabelle 2

	Präparat- Nummer	A	B	C	X	Y	Zn	Fp. [°C]
10	15	H	-(CH ₂) ₅ -		Cl	Cl	H	211
	16	H	CH ₃	cyclo-C ₃ H ₇	Cl	Cl	H	158
	17	H	CH ₃	H	Cl	Cl	H	150
	18	H	CH ₃	CH ₃	Cl	NO ₂	H	173
	19	H	CH ₃	i-C ₄ H ₉	Cl	Cl	H	117
15	20	H	CH ₃	CH ₃	F	CF ₃	H	>200
	21	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OCF ₃	H	116
	22	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇	Cl	Cl	H	153
	23	H	CH ₃	CH ₃	F	F	H	136
	24	H	CH ₃	CH ₃	Cl	F	H	132
20	25	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	H	
	26	H	CH ₃	CH ₃	Cl	Br	H	148
	27	H	CH ₃	CH ₃	F	Cl	H	>230

Vorprodukte für Verfahren B

25



30

(IV-1)

Zu 1,9 g (15 mmol) 2,2-Dimethyl-1H-pyrrolidin-3,5-dion,
gelöst in 50 ml absolutem Methylenchlorid, gibt man bei
35 0-10°C, 2,1 ml Triethylamin und 3,14 g (15 mmol) 2,4-Di-
chlor-benzoylchlorid, die ihrerseits in 5 ml absolutem
Methylenchlorid gelöst sind. Dann läßt man bei Raumtem-

5 peratur nachreagieren und kontrolliert den Reaktions-
ablauf durch Dünnschichtchromatographie.

Nach Beendigung der Reaktion entfernt man das Lösungsmittel im Vakuum, wäscht mit 200 ml 0,1 normaler Natriumhydroxid-Lösung nach, trocknet die organische Phase
10 mit Magnesiumsulfat und engt wiederum im Vakuum ein. Der Rückstand wird aus Essigester/n-Hexan umkristallisiert. Man erhält 3,2 g (71 % der Theorie) 4-(2,4-Dichlorbenzoyloxy)-5,5-dimethylpyrrolin-1H-2-on der Formel (IV-
15 1) mit Schmelzpunkt 167° C.

Tabelle 3

20	Präparat- Nummer	A	B	C	X	Y	Zn	Fp. [° C]
	IV-2	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	H	H	144
	IV-3	H	CH ₃	CH ₃	Cl	NO ₂	H	226
	IV-4	H	CH ₃	CH ₃	F	CF ₃	H	178
25	IV-5	H	CH ₃	CH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	O(CH ₂) ₂ OCH ₃	181
	IV-6	H	-(CH ₂) ₅ -		Cl	Cl	H	238
	IV-7	H	-(CH ₂) ₅ -		Cl	SO ₂ CH ₃	O(CH ₂) ₂ OCH ₃	193
	IV-8	H	CH ₃	cyclo- C ₃ H ₇	Cl	Cl	H	175
30	IV-9	H	CH ₃	H	Cl	Cl	H	137
	IV-10	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OCF ₃	H	136
	IV-11	H	CH ₃	i-C ₄ H ₉	Cl	Cl	H	128
	IV-12	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇	Cl	Cl	H	204
	IV-13	H	CH ₃	CH ₃	Cl	F	H	177
35	IV-14	H	CH ₃	CH ₃	F	F	H	184

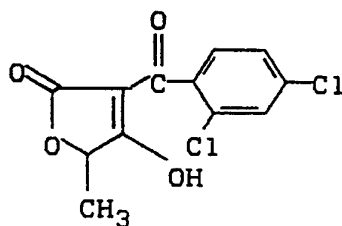
5 Tabelle 3

Präparat- Nummer	A	B	C	X	Y	Zn	Fp. [° C]
10 IV-15	H	CH ₃	CH ₃	Cl	Br	H	186
IV-16	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	H	176
IV-17	H	CH ₃	CH ₃	F	Cl	H	>220
IV-18	H	CH ₃	CH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	H	171

15 Anwendungsbeispiele

In den folgenden Anwendungsbeispielen wurde die nachstehend aufgeführte Verbindung als Vergleichssubstanz eingesetzt:

20



25

3-(2,4-Dichlorobenzoyl)-2,5-dihydro-4-hydroxy-5-methylfuran-2-on

30

35

5 Beispiel A

Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

10 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung
vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebene-
nen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emul-
15 gator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die
gewünschte Konzentration.

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät
und nach 24 Stunden mit der Wirkstoffzubereitung besos-
20 sen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit
zweckmäßigerweise konstant. Die Wirkstoffkonzentration
in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist
nur die Aufwandmenge des Wirkstoffs pro Flächeneinheit.
Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen
25 bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung
der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

30

Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit ebenso
wie in der Nutzpflanzenselektivität gegenüber dem Stand
der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindungen
gemäß folgender Herstellungsbeispiele: 2 und 6.

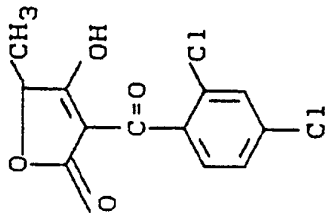
35

Tabelle A

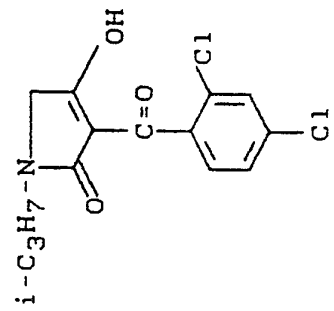
Pre-emergence-Test (Gewächshaus)

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Weizen	Mais	Cyperus	Digitaria	Amaranthus	Galin-soga	Stellaria
-----------	-------------------------	--------	------	---------	-----------	------------	------------	-----------

Stand der Technik:



Erfindung:



1000

0

0

0

0

50

0

0

(6) 1000

20

0

90

95

80

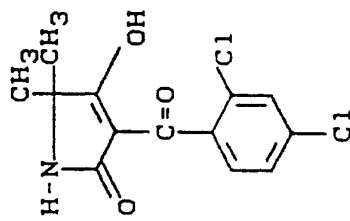
70

70

Tabelle A (Fortsetzung)

Pre-emergence-Test (Gewächshaus)

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Weizen	Mais	Cyperus	Digitaria	Amaranthus	Gallium	Stellaria
	(2) 1000	0	10	90	90	95	90	90



5 Beispiel B

Post-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

10 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

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

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben, so, daß die je-
20 weils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

25

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

30 Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit ebenso wie in der Nutzpflanzenselektivität gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindung gemäß Herstellungsbeispiel 2.

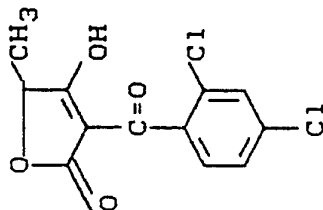
35

Tabelle B

Post-emergence-Test (Gewächshaus)

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Weizen	Abutilon	Datura	Portulak Solanum
-----------	-------------------------	--------	----------	--------	------------------

Stand der Technik:



40

0

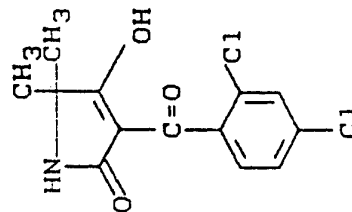
0

0

0

1000

Erfindung:



100

95

100

90

0

(2) 1000

5

Beispiel C

Plutella-Test

10 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykoether

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

Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die
20 Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen der Kohlschabe (*Plutella maculipennis*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt.
25 Dabei bedeutet 100 %, daß alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Raupen abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigt z.B. die Verbindung 4 der Her-
stellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem
30 Stand der Technik.

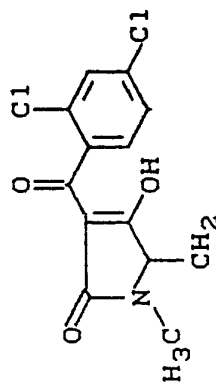
35

Tabelle C

Plutella-Test (pflanzen-schädigende Insekten)

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
------------	-----------------------------	---------------------------------

Bsp. 4



0,1

100

5

Beispiel D

Phaedon-Larven-Test

10

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

15

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

20

Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Meerrettichblattkäfer-Larven (*Phaedon cochleariae*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

25

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Käfer-Larven abgetötet wurden.

30

Bei diesem Test zeigt z.B. die Verbindung 8 der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik.

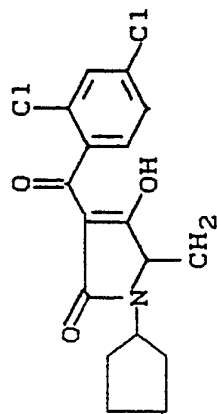
35

Tabelle D

Phaedon-Larven-Test (pflanzen-schädigende Insekten)

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
------------	-----------------------------	---------------------------------

Bsp. 8



0,1

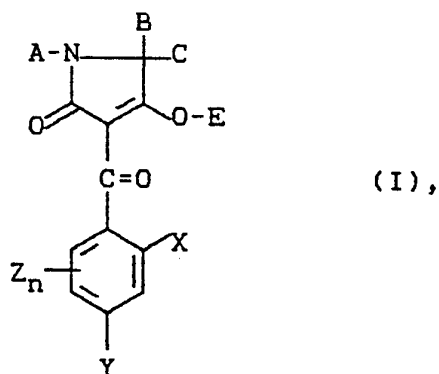
100

5

Patentansprüche

1. Substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-
Derivate der allgemeinen Formel (I)

10



15

20

in welcher

X für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder $-S(O)_m-R^1$ steht,

25

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder $-S(O)_m-R^1$ steht,

30

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkoxy, Alkoxyalkyl oder Alkoxy-carbonyl steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

35

m für eine Zahl von 0-2 steht,

5 A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituier-
 tes Alkyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl,
 Alkylthioalkyl, Alkenyl, Alkinyl, gegebenenfalls
 durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder
10 gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogen-
 alkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder
 Arylalkyl steht,

 B für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituier-
 tes Alkyl, Cycloalkyl, Alkoxyalkyl, Al-
15 kylthioalkyl oder gegebenenfalls durch Alkyl, Alko-
 oxy, Halogen, Nitro, Halogenalkyl, substituiertes
 Phenyl oder Aralkyl steht,

 C für Wasserstoff, oder gegebenenfalls durch
20 Halogen substituiertes Alkyl steht,

oder worin

 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden
25 sind, einen gegebenenfalls durch Halogen oder
 gegebenenfalls halogeniertes Alkyl oder Alkoxy
 substituierten gesättigten oder ungesättigten
 Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder
 Schwefel unterbrochen sein kann,

30

oder worin

 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie
 gebunden sind, einen gesättigten oder unge-
35 sättigten Cyclus bilden, der durch Halogen
 oder gegebenenfalls durch halogeniertes Alkyl

- 5 oder Alkoxy substituiert sein kann und durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann.
- 10 E für Wasserstoff (= E¹), oder für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Aralkyl (= E²), für eine Gruppe CO-R² (= E³) oder für ein Metallion oder Metallequivalent (= E⁴) steht,
- 15 R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder für einen gegebenenfalls substituierten Phenylrest steht und
- 20 R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylthio oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht.
- 25 2. Substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- 30 X für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Nitro, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Carboxy, Cyano oder S(O)_m-R¹ steht,
- 35

- 5 Y für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Carboxy, Cyano oder S(O)_m-R¹ steht,
- 10 Z für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy-carbonyl steht,
- 15 n für eine Zahl von 0-3 steht,
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- 20 A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8
- 25 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl-, C₁-C₆-Haloalkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,
- 30 B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₁-C₈-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das
- 35 durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen,

- 5 C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy,
Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl
steht,
- 10 C für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen
substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl steht, oder worin
- A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden
sind, einen 5 bis 8-gliedrigen gesättigten oder
ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff
15 und/oder Schwefel unterbrochen und durch ge-
gebenenfalls halogeniertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-
Alkoxy oder Halogen substituiert sein kann,
- oder worin
- 20 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie
gebunden sind einen 3 bis 8-gliedrigen gesättigten
oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauer-
stoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch
25 Halogen oder gegebenenfalls halogeniertes C₁-C₆-
Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy substituiert sein kann,
- E für E¹ = Wasserstoff,
für E² = C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₈-
30 Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₃-C₈-Halogenalkenyl, C₃-
C₈-Halogenalkinyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-
Halogenalkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-, Aryl-C₁-
C₆-alkyl,

- 5 für E³ = eine Gruppe CO-R² oder
für E⁴ = ein Metallion oder ein Metallequivalent
steht,
- 10 R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes
C₁-C₈-Alkyl, oder für gegebenenfalls durch Halogen,
Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-
C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkyl,
C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl steht und
- 15 R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes
C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, C₂-C₈-
Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl oder für gege-
benenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-
Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Phenyl, für
20 gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-
Halogenalkyl oder C₁-C₈-Alkoxy substituiertes Aryl-
C₁-C₆-alkyl steht.
- 25 3. Substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Deriva-
vate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch
gekennzeichnet, daß
- 30 X für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Al-
koxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
Nitro, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder
S(O)_m-R¹ steht,
- 35 Y für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-
Alkoxy, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,

- 5 Nitro, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder S(O)_m-R¹ steht,
- 10 Z für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy-carbonyl steht,
- 15 n für eine Zahl von 0-3 steht,
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- 20 A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Haloalkyl-, C₁-C₄-Alkoxy oder Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,
- 25
- 30 B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen das durch 1-2 Sauerstoff und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann, oder gegebenenfalls durch Halo-
- 35

- 5 gen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy
oder Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-C₄-
alkyl steht,
- 10 C für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen
substituiertes C₁-C₈-Alkyl steht, oder worin
- A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden
sind, einen 5 bis 7-gliedrigen gesättigten oder
15 ungesättigten Cyclus bilden, der durch C₁-C₄-Alkyl,
C₁-C₄-Alkoxy, Fluor oder Chlor substituiert und der
durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen
sein kann,
- oder worin
- 20 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie
gebunden sind, einen 3 bis 7-gliedrigen gesättigten
oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauer-
stoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch
25 Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-
Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiert sein
kann,
- E für E¹ = Wasserstoff
- 30 für E² = C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-
Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogen-
alkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, C₁-C₄-Al-
koxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₂-
C₄-alkyl, Aryl-C₁-C₄-alkyl,
- 35

- 5 für E³ = eine Gruppe CO-R² oder
für E⁴ = ein Metallion oder ein Metallequivalent
steht,
- 10 R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-
C₆-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor,
Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogen-
alkoxy, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Halogenalkylthio, C₁-
C₃-Alkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl substituiertes Phenyl,
steht und
- 15 R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-
C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₂-C₆-Al-
kenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl oder für gegeben-
falls durch Halogen, C₁-C₅-Halogenalkyl, C₁-C₅-Alkyl
20 oder C₁-C₅-Alkoxy substituiertes Phenyl, für gege-
benenfalls durch Halogen, C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₅-Halo-
genalkyl oder C₁-C₅-Alkoxy substituiertes Aryl-C₁-
C₄-alkyl steht.
- 25 4. Substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-
Derivate der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch
1, dadurch gekennzeichnet, daß
- 30 X für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl,
Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl,
Difluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Methoxy-
carbonyl Ethoxycarbonyl, Cyano oder S(O)_mR¹ steht,
- 35

- 80 -

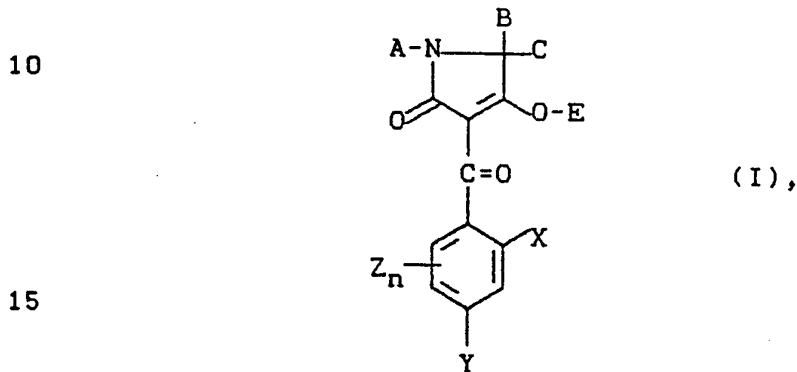
- 5 Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl,
Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom,
Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy,
Difluormethyl, Nitro, Methoxycarbonyl, Ethoxy-
10 carbonyl, Cyano oder $S(O)_m R^1$ steht,
- Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-
Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Tri-
15 fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethoxy,
Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Propoxyethyl, iso-Pro-
poxyethyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Tri-
fluormethoxycarbonyl, Trichlormethoxycarbonyl,
Difluormethoxycarbonyl steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,
20
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen sub-
stituiertes geradkettiges oder verzweigtes C_1-C_8 -
25 Alkyl, C_3-C_4 -Alkenyl, C_3-C_4 -Alkynyl, C_1-C_6 -Alkoxy-
 C_2-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -Polyalkoxy- C_2-C_4 -alkyl, C_1-C_6 -
Alkylthio- C_2-C_4 -alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ring-
atomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwe-
felatome unterbrochen sein kann oder gegebenen-
30 falls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-,

35

- 5 Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluor-
methyl-, Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-
C₃-alkyl steht,
- 10 B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₈-
Alkyl, C₁-C₄-AlkoxyC₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-
C₃-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch
1-2 Sauerstoff und/oder Schwefelatome unterbrochen
15 sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-
Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Nitro
substituiertes Phenyl oder Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,
- 20 C für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogen-
alkyl steht,
- oder worin
- 25 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden
sind, einen 5 bis 6-gliedrigen gesättigten oder
ungesättigten Cyclus bilden, der durch C₁-C₃-Alkyl,
C₁-C₃-Alkoxy, Fluor oder Chlor substituiert und der
durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen
sein kann,
- 30 oder worin
- 35 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an das sie ge-
bunden sind, einen 3 bis 6-gliedrigen gesättigten
oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauer-

- 5 stoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiert sein kann,
- E für E¹ = Wasserstoff steht,
- 10 für E² = C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₃-Halogenalkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkinyl, C₃-C₄-Halogenalkenyl, C₃-C₄-Halogenalkinyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₂-C₃-alkyl, C₁-C₃-Halogenalkoxy-C₂-C₃-alkyl, Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,
- 15 für E³ = eine Gruppe CO-R² oder
für E⁴ = Li[⊕], Na[⊕], K[⊕], NH₄[⊕] steht,
- R¹ für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkoxy, C₁-C₂-Fluoralkoxy, C₁-C₂-Chloralkoxy, C₁-C₂-Alkylthio, C₁-C₂-Fluoralkylthio, C₁-C₂-Chloralkylthio, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₂-Fluoralkyl, C₁-C₂-Difluoralkyl, C₁-C₂-Trifluoralkyl, C₁-C₂-Chloralkyl, C₁-C₂-Dichloralkyl, C₁-C₂-Trichloralkyl substituiertes Phenyl steht
- 25 und
- R² für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkoxy-(C₂-C₄)alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, Trifluormethyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Aryl-C₁-C₂-alkyl steht.
- 35

- 5 5. Verfahren zur Herstellung substituierter 3-Benzoyl-
pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel
(I)



in welcher

- 20 X für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogen-
alkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxycarbonyl, Carb-
oxy, Cyano oder $-S(O)_m-R^1$ steht,
- 25 Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenal-
kyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxycarbonyl, Carboxy,
Cyano oder $-S(O)_m-R^1$ steht,
- 30 Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, gegeb-
enfalls durch Halogen substituiertes Alkoxy, Al-
koxyalkyl oder Alkoxycarbonyl steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,
- 35 m für eine Zahl von 0-2 steht,

5 A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituier-
 tes Alkyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl,
 Alkylthioalkyl, Alkenyl, Alkinyl, gegebenenfalls
 durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder
10 gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogen-
 alkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder
 Arylalkyl steht,

 B für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituier-
 tes Alkyl, Cycloalkyl, Alkoxyalkyl, Al-
15 kylthioalkyl oder gegebenenfalls durch Alkyl,
 Alkoxy, Halogen, Nitro, Halogenalkyl, substitu-
 iertes Phenyl oder Aralkyl steht,

 C für Wasserstoff, oder gegebenenfalls durch
20 Halogen substituiertes Alkyl steht,

oder worin

 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden
25 sind, einen gegebenenfalls durch Halogen oder
 gegebenenfalls halogeniertes Alkyl oder Alkoxy
 substituierten gesättigten oder ungesättigten
 Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder
 Schwefel unterbrochen sein kann,

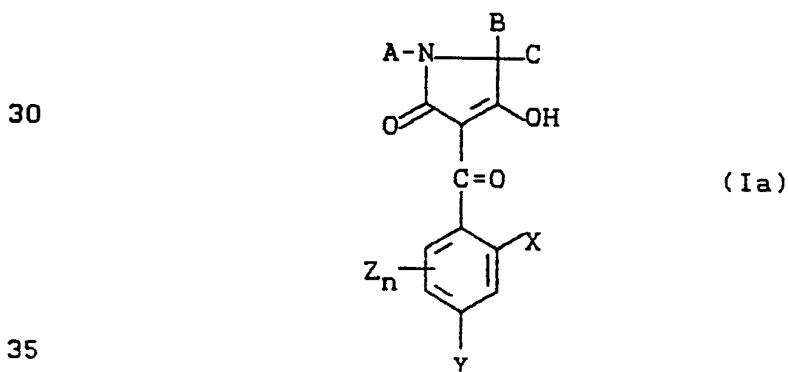
30

oder worin

 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie
 gebunden sind, einen gesättigten oder unge-
35 sättigten Cyclus bilden, der durch Halogen,

- 5 gegebeneneffalls durch halogeniertes Alkyl oder Alkoxy substituiert sein kann und durch Sauerstoff oder Schwefel unterbrochen sein kann,
- 10 E für Wasserstoff (= E¹), oder für gegebeneneffalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Aralkyl (= E²), für eine Gruppe CO-R² (= E³) oder für ein Metallion oder Metallequivalent (= E⁴) steht,
- 15 R¹ für gegebeneneffalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder für einen gegebeneneffalls substituierten Phenylrest steht und
- 20 R² für gegebeneneffalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylthio oder gegebeneneffalls substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht,

25 dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) bzw. deren Enole der Formel (Ia)



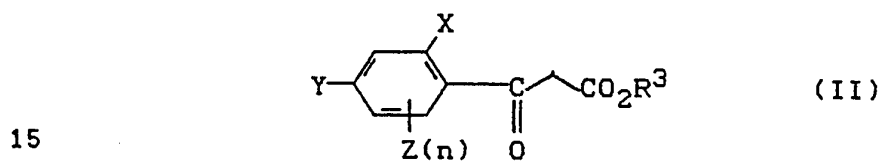
in welcher

- 86 -

5 A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen
haben,

erhält, wenn man

10 A) Benzoylessigester der Formel (II)

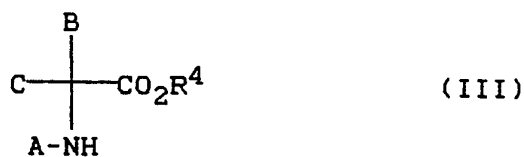


in welcher

20 X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen
haben und

R^3 für Alkyl steht

25 mit Aminosäureestern der allgemeinen Formel (III)



30

in welcher

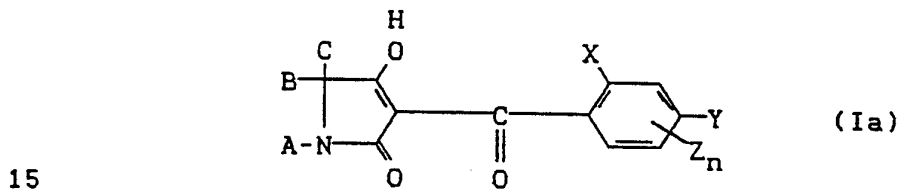
A, B und C die oben angegebenen Bedeutungen haben
und

35

R^4 für Alkyl steht,

5
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Lösungsmittels
 und in Gegenwart einer Base kondensiert, oder daß
 man

10 B) Verbindungen der Formel (Ia)



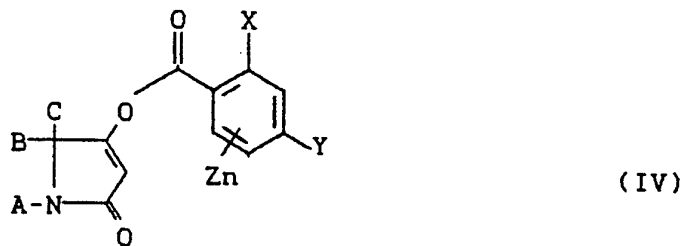
in welcher

20 A, B, C, X, Y, Z, und n die oben angegebenen
 Bedeutungen haben,

erhält, wenn man 4-Benzoyloxy-pyrrolin-2-one der
 Formel (IV)

25

30



35

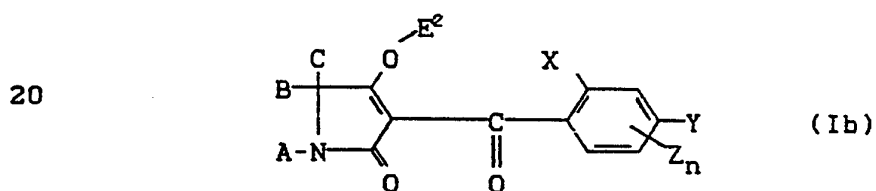
5 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Katalysators umlagert, oder daß man

15

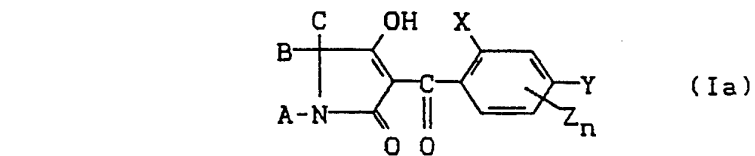
C) Verbindungen der Formel (Ib)



25 in welcher

A, B, C, E², X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

30 erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia),



5 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen
Bedeutungen haben,

10 mit Alkylierungsmitteln der allgemeinen Formel (V)



15 in welcher

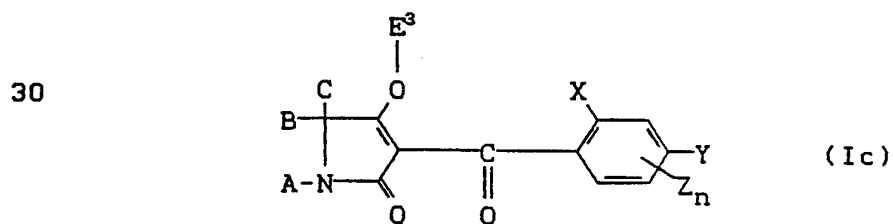
E^2 die oben angegebene Bedeutung hat und

L für Halogen, $-OSO_2$ -Alkyl, $-OSO_2O$ -Alkyl oder
20 $-OSO_2$ -Aryl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer
Base umgesetzt, oder daß man

25

D) Verbindungen der Formel (Ic)

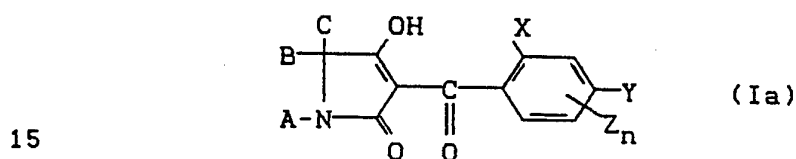


35

5 in welcher

A, B, C, E³, X, Y, Z und n die oben angegebenen
Bedeutungen haben,

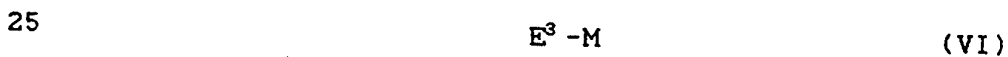
10 erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia)



in welcher

20 A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeu-
tungen haben,

mit Acylierungsreagenzien der Formel (VI)

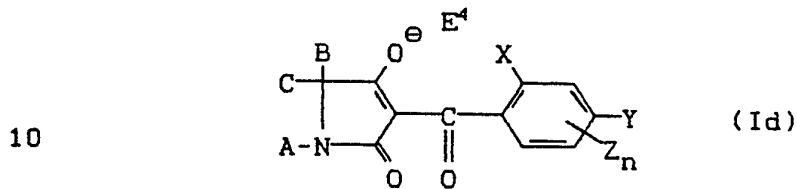


in welcher

30 E³ die oben angegebene Bedeutung hat und
M für Halogen, -OE³, CN, O-SO₂-Alkyl, O-
SO₂-Aryl und Imidazolyl steht,

35 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer
Base umgesetzt, oder daß man

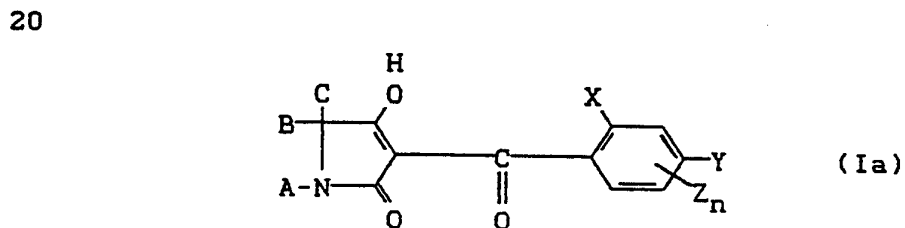
5 E) Verbindungen der allgemeinen Formel (Id)



in welcher

15 X, Y, Z, A, B, C, E⁴ und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia)

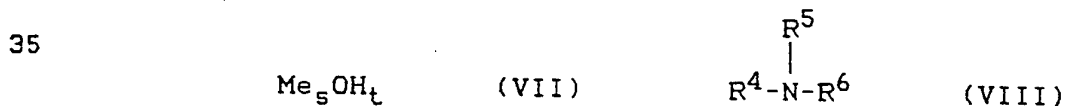


25

in welcher

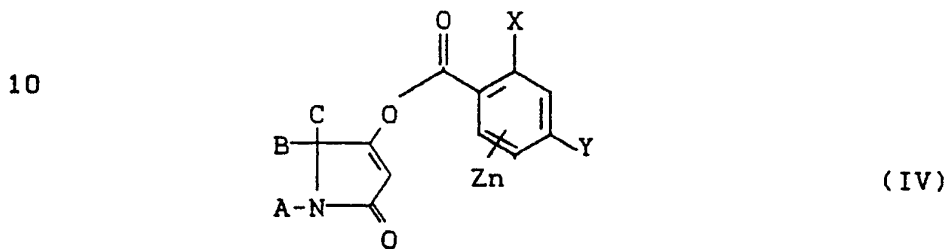
30 X, Y, Z, A, B, C und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Metallhydroxiden oder Aminen der allgemeinen Formel (VII) und (VIII)



- 5 in welchen
- Me für ein- oder zweiwertige Metallionen,
- 10 s und t für die Zahlen 1 und 2 stehen
- R⁴, R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für
Wasserstoff und Alkyl stehen,
- 15 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels, umgesetzt.
6. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanz-
zen, dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Benzoyl-
pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) gemäß
20 den Ansprüchen 1 bis 5 auf unerwünschte Pflanzen
und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
7. Verwendung von 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Deri-
vate der Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 5
25 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.
8. Verfahren zur Herstellung von herbiziden, insekti-
ziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man
3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel
30 (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 5 mit Streckmitteln
und/oder oberflächenaktiven Substanzen vermischt.
- 35

- 5 9. 4-Benzoyloxy-pyrrolin-2-one der allgemeinen Formel
(IV)



15 dadurch gekennzeichnet, daß

- 20 X für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder $-S(O)_m-R^1$ steht,
- 25 Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder $-S(O)_m-R^1$ steht,
- 30 Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkoxy, Alkoxyalkyl oder Alkoxy-carbonyl steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,

35

- 5 m für eine Zahl von 0-2 steht,
- A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen
substituiertes Alkyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxy-
alkyl, Alkylthioalkyl, Alkenyl, Alkynyl, ge-
10 gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes
Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-,
Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substi-
tuiertes Phenyl oder Arylalkyl steht,
- 15 B für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen
substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkoxyalkyl,
Alkylthioalkyl oder gegebenenfalls durch
Alkyl, Alkoxy, Halogen, Nitro, Halogenalkyl,
substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht,
- 20 C für Wasserstoff, oder gegebenenfalls durch
Halogen substituiertes Alkyl steht,
- oder worin
- 25 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie ge-
bunden sind, einen gesättigten oder ungesät-
tigten Cyclus bilden, der gegebenenfalls
durch Halogen oder gegebenenfalls durch halo-
30 geniertes Alkyl oder Alkoxy substituiert sein
kann und durch Sauerstoff und/oder Schwefel
unterbrochen sein kann,

oder worin

35

5 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das
sie gebunden sind, einen gesättigten oder
 ungesättigten Cyclus bilden, der durch
 Halogen oder gegebenenfalls durch haloge-
10 niertes Alkyl oder Alkoxy substituiert
sein kann und durch Sauerstoff und/oder
 Schwefel unterbrochen sein kann und

 R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituier-
 tes Alkyl oder für einen gegebenenfalls sub-
15 stituierten Phenylrest steht.

 10. Verfahren zur Bekämpfung von Insekten, dadurch ge-
 kennzeichnet, daß man 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-
 dion-Derivate der allgemeinen Formel (I) gemäß den
20 Ansprüchen 1 bis 5 auf Insekten und/oder ihren
Lebensraum einwirken läßt.

 11. Verwendung von 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Deri-
 vaten der allgemeinen Formel (I) gemäß den Ansprü-
25 chen 1 bis 5 zur Bekämpfung von Insekten.

30

35

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP93/01690

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.5 C07D 207/38; C07D 209/54; C07D 471/04 A01N 43/36
A01N 43/38; A01N 43/90; //(C07D 471/04, 221:00, 209:00)

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.5 C07D

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

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,Y	WO, A,8 804 652 (NIPPON SODA CO., LTD) 30 June 1988 cited in the application see the whole document	1-11
Y	EP, A,0 377 893 (BAYER AG) 18 July 1990 see the whole document	1-11
X	TETRAHEDRON LETTERS; Vol. 24, No. 43, 1983, OXFORD GB pages 4751-4754; R.C.F. JONES ET AL. 'Direct Metallation of Tetramic acids: A New Synthesis of 3-Acyl Tetramic Acids' see the whole document; in particular page 4753, formula 11a and 12a	1-4
X	JOURNAL OF INORGANIC BIOCHEMISTRY; Vol. 39, No. 4, 1990 NEW YORK US; pages 307-316; O. MARKOPOULOU ET AL. 'Synthesis of 3-Butanoyl-and -3-Benzoyl-4-hydroxy-3- pyrrolin-2-ones and their Complexes with Metal Ions' see the whole document, in particular page 308, formula 5	1-5

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
11 October 1993 (11.10.93)Date of mailing of the international search report
3 November 1993 (03.11.93)Name and mailing address of the ISA
European Patent Office

Authorized officer:

Facsimile No

Telephone No

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP93/01690

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	IL FARMACO; Vol. 47, No. 10, 1092, PAVIA IT pages 1323-1333; M. E. TRANQUILLINI 'Synthesis of 3-Aroyltetramic acids' see the whole document in particular page 1326, formula 6a-d and 11a-d -----	1-5

**ANNEX TO THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT
ON INTERNATIONAL PATENT APPLICATION NO.**

EP 9301690
SA 76121

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned international search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on
The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information. 11/10/93

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO-A-8804652	30-06-88	None	

EP-A-0377893	18-07-90	AU-B- 620193	13-02-92
		AU-A- 4764990	19-07-90
		CA-A- 2007239	07-07-90
		JP-A- 2225459	07-09-90
		US-A- 5045560	03-09-91
		US-A- 5186737	16-02-93

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

PCT/EP 93/01690

Internationales Aktenzeichen

I. KLASSIFIKATION DES ANMELDUNGSGEGENSTANDS (bei mehreren Klassifikationssymbolen sind alle anzugeben) ⁶		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
Int.Kl. 5 C07D207/38; A01N43/38;	C07D209/54; A01N43/90;	C07D471/04; A01N43/36 //(C07D471/04, 221:00, 209:00)
II. RECHERCHIERTE SACHGEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff ⁷		
Klassifikationssystem	Klassifikationssymbole	
Int.Kl. 5	C07D	
Recherchierte nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Sachgebiete fallen ⁸		
III. EINSCHLAGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN ⁹		
Art. ^o	Kennzeichnung der Veröffentlichung ¹¹ , soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile ¹²	Betr. Anspruch Nr. ¹³
X, Y	WO, A, 8 804 652 (NIPPON SODA CO., LTD.) 30. Juni 1988 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-11
Y	EP, A, 0 377 893 (BAYER AG) 18. Juli 1990 siehe das ganze Dokument ---	1-11
X	TETRAHEDRON LETTERS Bd. 24, Nr. 43, 1983, OXFORD GB Seiten 4751 - 4754 R.C.F. JONES ET AL. 'Direct Metallation of Tetramic acids: A New Synthesis of 3-Acyl Tetramic Acids' siehe das ganze Dokument, insbesondere Seite 4753, Formel 11a und 12a ---	1-4
-/--		
<p>^o Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen ¹⁰ :</p> <p>"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</p> <p>"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)</p> <p>"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht</p> <p>"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist</p> <p>"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden</p> <p>"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist</p> <p>"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</p>		
IV. BESCHEINIGUNG		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absenddatum des internationalen Recherchenberichts	
11. OKTOBER 1993	- 3. 11. 93	
Internationale Recherchenbehörde	Unterschrift des bevollmächtigten Bediensteten	
EUROPAISCHES PATENTAMT	ALLARD M. S.	

III. EINSCHLAGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN (Fortsetzung von Blatt 2)		
Art °	Kennzeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>JOURNAL OF INORGANIC BIOCHEMISTRY Bd. 39, Nr. 4, 1990, NEW YORK US Seiten 307 - 316 O. MARKOPOULOU ET AL. 'Synthesis of 3-Butanoyl- and 3-Benzoyl-4-hydroxy-3-pyrrolin-2-ones and their Complexes with Metal Ions' siehe das ganze Dokument, insbesondere Seite 308, Formel 5</p> <p style="text-align: center;">---</p>	1-5
P,X	<p>IL FARMACO Bd. 47, Nr. 10, 1092, PAVIA IT Seiten 1323 - 1333 M.E. TRANQUILLINI 'Synthesis of 3-Aroyltetramic acids' siehe das ganze Dokument, insbesondere Seite 1326, Formel 6a-d und 11a-d</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	1-5

**ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT
 ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.**

EP 9301690
 SA 76121

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentdokumente angegeben.
 Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am
 Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

11/10/93

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO-A-8804652	30-06-88	Keine	
EP-A-0377893	18-07-90	AU-B- 620193	13-02-92
		AU-A- 4764990	19-07-90
		CA-A- 2007239	07-07-90
		JP-A- 2225459	07-09-90
		US-A- 5045560	03-09-91
		US-A- 5186737	16-02-93

EPO FORM P0473

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82